

AN 1991-103702 [15] WPIDS

DNC C1991-044473

TI New pantothenic acid derivs. - are ACAT inhibitors in prevention and treatment of hyperlipidaemia, arteriosclerosis, angina pectoris, myocardial infarction and thrombosis.

DC B03 B05

IN IKAWA, H; KOBAYASHI, N; KUSUNOKI, J; MATSUMOTO, H

PA (FJRE) FUJI REBIO INC; (FJRE) FUJIREBIO KK; (FJRE) FUJI REBIO KK

CYC 9

PI EP 421441 A 19910410 (199115)\* 158p

R: CH DE FR GB LI NL

JP 03218340 A 19910925 (199145) <--

JP 03218350 A 19910925 (199145)

JP 03218366 A 19910925 (199145)

US 5120738 A 19920609 (199226) 81p

EP 421441 B1 19950125 (199508) EN 186p

R: CH DE FR GB LI NL

DE 69016335 E 19950309 (199515)

JP 2532299 B2 19960911 (199641) 132p

KR 9607800 B1 19960612 (199919) #

JP 2997535 B2 20000111 (200007) 54p

JP 2997536 B2 20000111 (200007) 30p

ADT EP 421441 A EP 1990-119090 19901005; JP 03218340 A JP 1990-265090  
19901004; JP 03218350 A JP 1990-293523 19901101; JP 03218366 A JP  
1990-293524 19901101; US 5120738 A US 1990-598900 19901005; EP 421441 B1  
EP 1990-119090 19901005; DE 69016335 E DE 1990-616335 19901005, EP  
1990-119090 19901005; JP 2532299 B2 JP 1990-265090 19901004; KR 9607800 B1  
KR 1991-2917 19910222; JP 2997535 B2 JP 1990-293523 19901101; JP 2997536  
B2 JP 1990-293524 19901101

FDT DE 69016335 E Based on EP 421441; JP 2532299 B2 Previous Publ. JP  
03218340; JP 2997535 B2 Previous Publ. JP 03218350; JP 2997536 B2 Previous  
Publ. JP 03218366

PRAI JP 1989-286759 19891102; JP 1989-261610 19891006; JP 1989-286758  
19891102; JP 1990-265090 19901004; JP 1990-293524 19901101; JP  
1990-293523 19901101; KR 1991-2917 19910222

AN 1991-103702 [15] WPIDS

AB EP 421441 A UPAB: 19930928

Pantothenic acid derivs. of formula (I) are new; R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> = H or an OH protecting group. R<sub>3</sub> = opt. unsatd. or cyclic 5-25C aliphatic hydrocarbon (II) (which is opt. substd. by an aromatic gp. or -NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>, where R<sub>4</sub> is the same as (II) and R<sub>5</sub> is H or an opt. unsatd. or cyclic hydrocarbon which may be subst. by an aromatic gp.; Q = (a)-X<sub>1</sub>-A-y<sub>1</sub>-, where A is an opt. unsatd. or cyclic 2-16C aliphatic hydrocarbon (which may be subst. by an aromatic gp. or an aromatic hydrocarbon or heterocyclic and one of X<sub>1</sub> and Y<sub>1</sub> is N(R<sub>6</sub>)- and the other is -O-, -S- or N(R<sub>7</sub>)-, where R<sub>6</sub> and R<sub>7</sub> are H or lower alkyl; (b)-X<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-Y<sub>2</sub>-, where one of X<sub>2</sub> and Y<sub>2</sub> is a 4-7 membered

N-contg. heterocycle, and the other is -O-, -S- or -N(R6)-, and q = 0, 1 or 2, or (c) piperazinyl or tetrahydro-1, 4-diazepinyl. n = 1,2,3 or 4.

The daily oral or rectal dose is 2-500 mg/Kg, taken 1-4 times daily.

USE/ADVANTAGE - (I) are good acyl CoA-cholesterol-acyltransferase inhibitors in the prevention and treatment of hyperlipidaemia, arteriosclerosis, angina pectoris, myocardial infarction and thrombosis.

0/0

ABEQ US 5120738 A UPAB: 19930928

Pantothenic acid derivs. of formula (I) are new. R1 and R2 are each H or OH-protecting gp. or together form ylidene gp.; R3 is (1) (un)satd. 5-25C monovalent aliphatic hydrocarbon (less than 10C if cyclic) opt. subst. by 6-10C aromatic hydrocarbon or 5-10 ring C aromatic heterocyclic with 1-4 O, S or N atoms, substs. opt. subst. or (2) R3 is -NR4R5 where R4 is as (1) above and R5 is H, or as (1) above; Q is -X1-A-Y1 where A is (un)satd. divalent 2-16C aliphatic hydrocarbon (or if cyclic up to 7C) opt. subst. by 6-10C aromatic gp. or heteroaryl, viz. furyl, thienyl, pyridyl or indolyl or is 6-10C divalent aromatic or 5-10C divalent heterocyclic with 1 or 2 N, O or S atoms; one of X1 and Y1 is =NR6 and the other is O, S or =NR7 with R6 and R7 each H or 1-6C alkyl; Q is -X2(CH2)t-Y2- where one of X2 and Y2 is (a) and the other is O, S or N where (a) is 4 to 7-membered divalent N-contg. aromatic heterocyclic; or Q is (b) with m is 2 or 3; n is 1-4 and l is 0, 1 or 2. Prepn. comprises reacting (II) with R3-COZ1 (III) or R4-NCO (IV) where X is H, halo, etc.

USE - ACAT inhibitors used to decrease cholesterol esterification and intestinal and intracellular uptake. Used to treat atherosclerosis, etc. at dosage e.g. 2-500 mg/kg/day.

ABEQ EP 421441 B UPAB: 19950301

Compounds represented by general formula (I) wherein R1 and R2, which are the same or different, each represent a hydrogen atom or a protective group for a hydroxyl group; R3 represents a saturated or unsaturated linear, branched or cyclic, monovalent C5-C25-aliphatic hydrocarbon group which may be substituted with an aromatic group or a group of formula -NR4R5 where R4 represents a saturated or unsatd. linear, branched or cyclic, monovalent C5-C25-aliphatic hydrocarbon group which may be subst. with an aromatic group, and R5 represents a hydrogen atom or a satd. or unsatd. linear, branched or cyclic, monovalent hydrocarbon group which may be subst. with an aromatic group; Q represents (a) a group of formula -X1-A-Y1-, where A represents a satd. or unsatd. linear, branched or cyclic divalent C2-C16-aliphatic hydrocarbon group which may be subst. with an aromatic group, a divalent aromatic hydrocarbon of X1 and Y1 represents -NR6 and the other represents -O-, -S- or -NR7 in which R6 and R7 each represent a hydrogen atom or a C1 to C6 alkyl group; (b) a group of formula -X2-(CH2)t-Y2, where one of X2 and Y2 represents a group of formula (i), and the other represents -O-, -S- or -NR6 in which gp. (i) represents a 4-7 membered, divalent nitrogen-contg. non aromatic heterocyclic group and R6 has the same meaning as defined above, and l is

0, 1 or 2; or (c) a group of formula (ii) where m is 2 or 3; n is an integer of from 1 to 4, provided that if Q represents the group of formula  $-X_1-A-Y_1-$ , X<sub>1</sub> represents  $-NR_6$  and A is  $-CH_2-CH_2-$ , then Y<sub>1</sub> cannot represent  $-S-$ .

Dwg.0/0

(19)日本国特許庁 (JP)

## (12) 特許公報 (B2)

(11)特許番号

第2532299号

(45)発行日 平成8年(1996)9月11日

(24)登録日 平成8年(1996)6月27日

(51) Int.Cl.<sup>6</sup>  
 C 07 C 235/12  
 A 61 K 31/16  
 31/21  
 31/255  
 31/335

識別記号 ABN  
 ADN  
 AED

府内整理番号

F I  
 C 07 C 235/12  
 A 61 K 31/16  
 31/21  
 31/255  
 31/335

ABN  
 ADN  
 AED

技術表示箇所

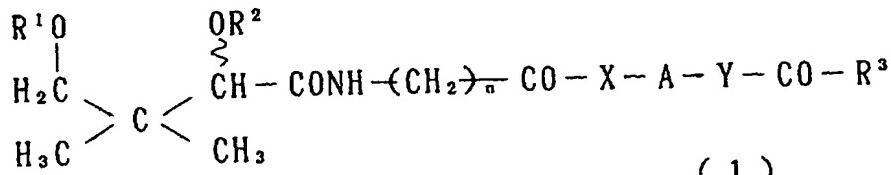
請求項の数1(全132頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願平2-265090  
 (22)出願日 平成2年(1990)10月4日  
 (65)公開番号 特開平3-218340  
 (43)公開日 平成3年(1991)9月25日  
 (31)優先権主張番号 特願平1-261610  
 (32)優先日 平1(1989)10月6日  
 (33)優先権主張国 日本(JP)

(73)特許権者 99999999  
 富士レビオ株式会社  
 東京都新宿区西新宿2丁目7番1号  
 伊川 博  
 東京都新宿区下落合4丁目6番7号 富士レビオ株式会社内  
 (72)発明者 松本 一  
 東京都新宿区下落合4丁目6番7号 富士レビオ株式会社内  
 小林 信雄  
 東京都新宿区下落合4丁目6番7号 富士レビオ株式会社内  
 (72)発明者 楠 淳  
 東京都新宿区下落合4丁目6番7号 富士レビオ株式会社内  
 (74)代理人 弁理士 下坂 スミ子  
 審査官 佐藤 修

(54)【発明の名称】 パントテン酸誘導体

(57)【特許請求の範囲】



式中、

 $R^1$ 及び $R^2$ は同一もしくは相異なり、各々水素原子又は水酸基の保護基を表わし； $R^3$ は飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換されていてもよい $C_5 \sim C_{25}$ 一価脂肪族炭化水素基又は基

10

$- N \begin{cases} R^4 \\ R^5 \end{cases}$

を表わし、  
 ここで、 $R^4$ は飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の $C_5 \sim C_{25}$ 一価脂肪族炭化水素基を表わし、且つ $R^5$ は水素原子又は飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換されてい

(2)

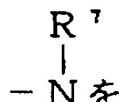
3

てもよい一価脂肪族炭化水素基を表わし；  
 Aは飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換されていてもよいC<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>二価脂肪族炭化水素基、二価芳香族炭化水素基又は二価芳香族複素環式基を表わし；

X及びYのいずれか一方は



を表わし且つ他方は-O-, -S-又は



を表わし、

ここで、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は各々水素原子又は低級アルキル基を表わし；

nは1～4の整数である、  
で示される化合物。

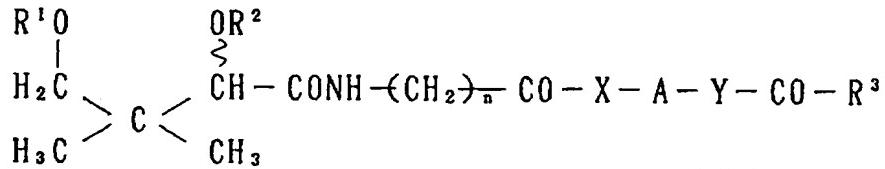
#### 【発明の詳細な説明】

##### 〈産業上の利用分野〉

本発明は、アシルCoA-コレステロールーアシル転位酵素 (Acyl CoA-Cholesterol-Acyltransferase—以下“ACAT”と略称する) の阻害活性に優れたパンテン酸誘導体に関する。

##### 〈従来の技術及び課題〉

近年、動脈硬化症のうち一般的にみられる粥状硬化症においては、動脈硬化発症の最も初期から脂肪沈着が認められ、この蓄積する脂肪の主体はコレステロールであり、更に、数多くの病理組織学的および生化学的研究により、このコレステロールが血漿脂質に由来することが明らかになった。また、種々の疫学的調査によって、高脂血症は動脈硬化性疾患の主要な危険因子であることが示されている。従って、高脂血症の治療は動脈硬化性疾患のリスクを軽減する意味で益々重要となり、その治療薬についても単に血清脂質レベルを低下させるだけではなく、血清脂質バランスを改善し、或いは、動脈硬化の\*



式中、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は同一もしくは相異なり、各々水素原子又は水酸基の保護基を表わし；

R<sup>3</sup>は飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換されていてもよいC<sub>5</sub>～C<sub>25</sub>一価脂肪族炭化水素基又は基

4

\* 発症を積極的に予防し得る薬剤の出現が望まれている。

高脂血症治療薬としては既に数多くの薬剤が提供されており、総血清コレステロールの低下に関してはある程度の臨床的効果をあげているが、動脈硬化性疾患による死亡率の低減については必ずしも十分な効果が認められていない。また、近年、脂質代謝系の解明に伴い血清脂質バランスをコントロールする薬剤、即ち、高密度リポタンパク (HDL) の血清レベルを高め、低密度リポタンパク (LDL) のレベルを低下させるのに有効な薬剤或いは、コレステロールの合成を阻害し結果として血清脂質レベルを低下させる薬剤 (HMGCoA reductase inhibitors) 等の開発が進められている。しかし、このような薬剤も血中脂質レベルの改善には有効ではあるが、腸管壁からの食事性コレステロールの吸収の制御には殆ど効果がなく、更に、動脈硬化の発症または進展を積極的に予防し得る作用を有しておらず、動脈硬化性疾患のリスクを軽減し得るものであるかどうかは今後の検討を待たなければならない。

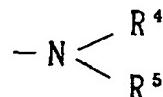
一方、膜内在性酵素として知られるACATは肝臓および20 小腸の細胞内ミクロソームに多く存在し、コレステロールエステルの合成を司っている。また、この酵素には、現在、二種のisozymeの存在が知られているが、これらの構造及びその生理的役割等については、この酵素の単離精製が困難なため未だ解明されていない。しかし、ACATはコレステロールの腸間における吸収及び細胞内へのコレステロールエステルとしての蓄積に関与し、動脈硬化巣ではその活性が昂進していることが知られており、本酵素の阻害剤は、コレステロール吸収阻害に基づく血中脂質低下作用と同時に抗動脈硬化作用を併せ持つ薬剤としての有用性が期待される。

そこで、本発明者らは優れたACAT阻害活性を有する物質を合成すべく鋭意研究を行なった結果、今回、本発明を完成するに至ったものである。

##### 〈発明の開示〉

本発明によれば、下記一般式

( I )



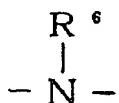
を表わし、

ここで、R<sup>4</sup>は飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状のC<sub>5</sub>～C<sub>25</sub>一価脂肪族炭化水素基を表わし、且つR<sup>5</sup>は水素原子又は飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換されてい

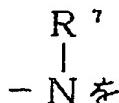
(3)

5

てもよい一価脂肪族炭化水素基を表わし；  
 Aは飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換されていてもよい $\beta_2$ ～C<sub>16</sub>二価脂肪族炭化水素基、二価芳香族炭化水素基又は二価芳香族複素環式基を表わし；  
 X及びYのいずれか一方は



を表わし且つ他方は-O-, -S-又は



を表わし、

ここで、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は各々水素原子又は低級アルキル基を表わし；

nは1～4の整数である、

で示される化合物が提供される。

本明細書において「低級」なる語は、この語で修飾された原子団又は化合物の炭素数が6個以下好ましくは4個以下であることを表わすために使用するものである。

また、「水酸基の保護基」は加水分解又は水素添加分解により離脱することのできる任意の保護基であることができ、例えば以下に例示するものを挙げることができる。メチル、メトキシエチル、メチルチオメチル、ベンジルオキシメチル、t-ブロキシメチル、2-メトキシエトキシメチル、2,2,2-トリクロロエトキシメチル、ビス(2-クロロエトキシ)メチル、1-エトキシエチル、1-メチル-1-メトキシエチル、1-(イソプロポキシ)エチル、2,2,2-トリクロロエチル、t-ブチル、アリル、シンナミル、ベンジル、p-メトキシベンジル、o-ニトロベンジル、p-ニトロベンジル、p-クロロベンジル、o-クロロベンジル、p-シアノベンジル、ジフェニルメチル、 $\alpha$ -ナフチルジフェニルメチル、トリフェニルメチル、ジ(p-メトキシフェニル)メチル等の置換又は無置換アルキル又はアルケニル基；テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、4-メトキシテトラヒドロピラニル、4-メトキシテトラヒドロチオピラニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチオフラニル等の複素環式基；トリメチルシリル、トリエチルシリル、イソプロピルジメチルシリル、t-ブチルジメチルシリル、t-ブチルジフェニルシリル、メチルジt-ブチルシリル、トリベンジルシリル、トリフェニルシリル、トリイソプロピルシリル等の置換シリル基；ホルミル、アセチル、プロピオニル、クロロアセチル、ジクロロアセチル、トリクロロアセチル、トリフルオロアセチル、メトキシアセチル、トリフェニルメトキシアセチル、フェノキシアセチル、p-クロロフェノキシアセチル、2,6-ジクロロ-4-メチルフェノキシアセチル、フェニルア

6

セチル、クロロジフェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、3-ベンゾイルプロピオニル、イソブチロイル、モノスクシノイル、4-オキソペンタノイル、ピバロイル、2-ブテノイル、(E)-2-メチル-2-ブテノイル、ベンゾイル、2-クロロベンゾイル、3-ニトロベンゾイル、2-フルオロベンゾイル、3-トロフレオロメチルベンゾイル、3-トリクロロメチルベンゾイル、4-フェニルベンゾイル、2,4,6-トリメチルベンゾイル、 $\alpha$ -ナフトイル等のアシル基；メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、2,2,2-トリエトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、ビニルオキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、シンナミルオキシカルボニル、p-ニトロフェノキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、p-メトキシベンジルオキシカルボニル、3,4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル、o-ニトロベンジルオキシカルボニル、p-ニトロベンジルオキシカルボニル等の置換オキシカルボニル基；フェニルカルバモイル、ナフチルカルバモイル、トルイルカルバモイル、フルオロフェニルカルバモイル、ジフルオロフェニルカルバモイル、ニトロフェニルカルバモイル、シアノフェニルカルバモイル、ベンジルカルバモイル、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、イソブロピルカルバモイル、ブチルカルバモイル、シクロヘキシカルバモイル、シクロプロピルメチルカルバモイル、フェニルチオカルバモイル、ナフチルチオカルバモイル、トルイルチオカルバモイル、フルオロフェニルチオカルバモイル、ニトロフェニルチオカルバモイル、シアノフェニルチオカルバモイル、ベンジルチオカルバモイル、プロピルチオカルバモイル、ブチルチオカルバモイル等の置換カルバモイル基など。

また、前記式(I)においてR<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が水酸基の保護基を表わす場合には、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>とは一緒になって、メチレン、エチリデン、1-t-ブチルエチリデン、1-フェニルエチリデン、2,2,2-トリクロロエチリデン、イソブロピリデン、ブチリデン、シクロヘンチリデン、シクロヘキシリデン、シクロヘプチリデン、ベンジリデン、p-メトキシベンジリデン、2,4-ジメトキシベンジリデン、p-ジメチルアミノベンジリデン、o-ニトロベンジリデン、メトキシメチレン、エトキシメチレン、ジメトキシメチレン、1-メトキシエチリデン、1,2-ジメトキシエチリデン、 $\alpha$ -メトキシベンジリデン等のイリデン基を形成することもできる。

「飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の一価脂肪族炭化水素基」としては、例えば次のものが挙げられる。

(1) アルキル基：例えば、  
 メチル、エチル、プロピル、イソブロピル、ブチル、イソブチル、t-ブチル、ペンチル、ネオペンチル、イソペンチル、t-ペンチル、1-エチルペンチル、1-イ

50

(4)

7

ソプロピルペンチル、1-t-ブチルベンチル、2-エチルベンチル、2-イソプロピルベンチル、2-t-ブチルベンチル、3-エチルベンチル、3-イソプロピルベンチル、3-t-ブチルベンチル、ヘキシル、1-エチルヘキシル、1-イソプロピルヘキシル、1-t-ブチルヘキシル、2-エチルヘキシル、2-イソプロピルヘキシル、2-t-ブチルヘキシル、3-エチルヘキシル、3-イソプロピルヘキシル、3-t-ブチルヘキシル、ヘプチル、1-エチルヘプチル、1-イソプロピルヘプチル、1-エチルヘプチル、2-ネオペンチルヘプチル、2-エチルヘプチル、2-イソプロピルヘプチル、2-ネオペンチルヘプチル、3-エチルヘプチル、3-イソプロピルヘプチル、3-ネオペンチルヘプチル、オクチル、1-エチルオクチル、1-イソプロピルオクチル、1-t-ブチルオクチル、2-エチルオクチル、3-イソプロピルオクチル、4-t-ブチルオクチル、ノニル、1-メチルノニル、1-エチルノニル、1-イソプロピルノニル、1-イソブチルノニル、2-メチルノニル、2-エチルノニル、3-イソプロピルノニル、4-イソブチルノニル、デシル、1-エチルデシル、1,1-ジエチルデシル、1-t-ブチルデシル、3-エチルデシル、1,3-ジエチルデシル、2-t-ブチルデシル、ウンデシル、1-イソプロピルウンデシル、1,1-ジエチルウンデシル、2-イソプロピルウンデシル、1,2-ジエチルウンデシル、ドデシル、1-t-ブチルドデシル、1-イソプロピルドデシル、1,1-ジエチルドデシル、2-t-ブチルドデシル、3-イソプロピルドデシル、2,4-ジエチルドデシル、トリデシル、1,1-ジエチルトリデシル、1-t-ブチルトリデシル、1,5-ジエチルトリデシル、3-t-ブチルトリデシル、テトラデシル、1-イソブチルテトラデシル、ペンタデシル、1-メチルペンタデシル、1,1-ジメチルペンタデシル、1-エトキシペンタデシル、1,1-ジエチルペンタデシル、1-イソプロピルペンタデシル、1-t-ブチルペンタデシル、2-イソブチルテトラデシル、3-メチルペンタデシル、2,6-ジメチルペンタデシル、2-エチルペンタデシル、1,4-ジエチルペンタデシル、3-イソプロピルペンタデシル、2-t-ブチルペンタデシル、ヘキサデシル、1,1-ジメチルヘキサデシル、1-メチルヘキサデシル、1-エチルヘキサデシル、1-t-ブチルヘキサデシル、1,3-ジメチルヘキサデシル、2-メチルヘキサデシル、4-エチルヘキサデシル、3-イソプロピルヘキサデシル、4-t-ブチルヘキサデシル、ヘプタデシル、1-メチルヘプタデシル、1,1-ジメチルヘプタデシル、1-エチルヘプタデシル、1-イソプロピルヘプタデシル、1-t-ブチルヘプタデシル、2-メチルヘプタデシル、3,5-ジメチルヘプタデシル、2-エチルヘプタデシル、5-イソプロピルヘプタデシル、3-t-ブチルヘプタデシル、オクタデシル、1-メチルオクタデシル、1,1

8

-ジメチルオクタデシル、1-エチルオクタデシル、1-ジエチルオクタデシル、2-メチルオクタデシル、2,3-ジメチルオクタデシル、5-エチルオクタデシル、1,2-ジエチルオクタデシル、ノナデシル、1-メチルノナデシル、1,1-ジメチルノナデシル、1-t-ブチルノナデシル、2-メチルノナデシル、2,3-ジメチルノナデシル、3-t-ブチルノナデシル、イコシル、1-メチルイコシル、1,1-ジメチルイコシル、1-エチルイコシル、1-t-ブチルイコシル、4-メチルイコシル、2,2-ジメチルイコシル、3-エチルイコシル、2-t-ブチルイコシルなど。

(2) アルケニル基: 例えば

ビニル、1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、1-メチル-1-ブテニル、2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、1-エチル-3-ペンテニル、4-ペンテニル、1,3-ペントジエニル、2,4-ペントジエニル、1-ヘキセニル、1-メチル-2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、1-ブチル-5-ヘキセニル、1,3-ヘキサジエニル、2,4-ヘキサジエニル、1-ヘプテニル、2-ヘプテニル、3-ヘプテニル、4-ヘプテニル、5-ヘプテニル、6-ヘプテニル、1,3-ヘプタジエニル、2,4-ヘプタジエニル、1-オクテニル、2-オクテニル、3-オクテニル、4-オクテニル、5-オクテニル、6-オクテニル、7-オクテニル、1-ノネニル、2-ノネニル、3-ノネニル、4-ノネニル、5-ノネニル、6-ノネニル、7-ノネニル、8-ノネニル、9-デセニル、1-メチル-9-デセニル、1,1-ジメチル-9-デセニル、1-エチル-9-デセニル、6-ウンデセニル、1-メチル-6-ウンデセニル、1,1-ジメチル-6-トライデセニル、8-トライデセニル、1-メチル-8-トライデセニル、1,1-ジメチル-8-トライデセニル、10-トライデセニル、1-メチル-10-トライデセニル、1,1-ジメチル-10-トライデセニル、10-ペンタデセニル、1-メチル-10-ペンタデセニル、1,1-ジメチル-10-ペンタデセニル、8-ペンタデセニル、1-メチル-8-ペンタデセニル、1,1-ジメチル-8-ペンタデセニル、12-ヘプタデセニル、1-メチル-12-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニル、10-ヘプタデセニル、1-メチル-10-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニル、8-ヘプタデセニル、1-メチル-8-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル、1-エチル-8-ヘプタデセニル、8,11-ヘプタデカジエニル、1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニル、8,11,14-ヘプタデカトリエニルなど。

(3) アルキニル基: 例えば

プロパギル、2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニ

(5)

9

ル、2-ペニチニル、1-エチル-3-ペニチニル、1-イソプロピル-4-ペニチニル、1,3-ペニタジイニル、2,4-ペニタジイニル、1-ヘキシニル、1-メチル-2-ヘキシニル、2-メチル-3-ヘキシニル、1-エチル-4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1,3-ヘキサジイニル、2,4-ヘキサジイニル、1-ヘプチニル、1-メチル-2-ヘプチニル、3-ヘプチニル、1-エチル-4-ヘプチニル、2-プロピル-5-ヘプチニル、2-エチル-6-ヘプチニル、1,3-ヘプタジイニル、2,4-ヘプタジイニル、1-オクチニル、1-メチル-2-オクチニル、3-メチル-1-オクチニル、4-メチル-1-オクチニル、1-メチル-5-オクチニル、6-メチル-1-オクチニル、7-オクチニル、1-ノニニル、2-メチル-1-ノニニル、3-メチル-1-ノニニル、1-メチル-4-ノニニル、5-ノニニル、6-メチル-1-ノニニル、1-メチル-7-ノニニル、8-ノニニル、9-デシニル、1-メチル-9-デシニル、1,1-ジメチル-9-デシニル、1-エチル-9-デシニル、6-ウンデシニル、1-メチル-6-ウンデシニル、1,1-ジメチル-6-ウンデシニル、6-トリデシニル、1-メチル-6-トリデシニル、1,1-ジメチル-6-トリデシニル、8-トリデシニル、1-メチル-8-トリデシニル、1,1-ジメチル-8-トリデシニル、10-トリデシニル、1-メチル-10-トリデシニル、1,1-ジメチル-10-トリデシニル、10-ペニタデシニル、1-メチル-10-ペニタデシニル、1,1-ジメチル-10-ペニタデシニル、8-ペニタデシニル、1-メチル-8-ペニタデシニル、1,1-ジメチル-8-ペニタデシニル、12-ヘプタデシニル、1-メチル-12-ヘプタデシニル、1,1-ジメチル-12-ヘプタデシニル、10-ヘプタデシニル、1-メチル-10-ヘプタデシニル、1,1-ジメチル-10-ヘプタデシニル、8-ヘプタデシニル、1-メチル-8-ヘプタデシニル、1-エチル-8-ヘプタデシニル、8,11-ヘプタデカジイニル、1-メチル-8,11-ヘプタデカジイニル、8,11,14-ヘプタデカトリイニルなど。

(4) シクロアルキル基：例えば

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、パーキドロナフチルなど。

(5) シクロアルケニル基：例えば

シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、シクロオクテニル、シクロペンタキエニル、シクロヘキサジエニル、シクロヘプタジエニル、シクロオクタジエニルなど。

(6) シクロアルキルアルキル基：例えば

シクロヘキシリメチル、シクロペンチルメチル、(4-イソプロピルシクロヘキシリ)メチル、(4-t-ブチルシクロヘキシリ)メチル、(4-ネオパンチルシクロ

10

ヘキシル) メチル、2-シクロペンチルエチル、2-シクロヘキシリエチル、3-シクロペンチルプロピル、3-シクロヘキシリプロピル、1-シクロペンチルベンチル、1-シクロヘキシリベンチル、1-シクロヘキシリメチルベンチル、3-シクロペンチルベンチル、2-シクロヘキシリメチルベンチル、1-(4-t-ブチルシクロヘキシリ) メチルベンチル、1-シクロペンチルヘキシリ、1-シクロヘキシリヘキシリ、1-シクロペンチルメチルヘキシリ、2-シクロペンチルヘキシリ、2-シクロヘキシリヘキシリ、3-シクロペンチルメチルヘキシリ、1-(4-ネオペンチルシクロヘキシリ) メチルヘキシリ、1-シクロペンチルヘブチル、1-シクロヘキシリメチルヘブチル、1-(4-イソプロピルシクロヘキシリ) メチルヘブチル、3-シクロペンチルヘブチル、2-シクロヘキシリメチルヘブチル、4-(4-イソプロピルシクロヘキシリ) メチルヘブチル、1-シクロペンチルオクチル、1-シクロヘキシリオクチル、1-シクロペンチルメチルオクチル、2-シクロペンチルオクチル、3-シクロヘキシリオクチル、2-シクロペンチルメチルオクチル、1-シクロペンチルノニル、1-シクロヘキシリノニル、1-シクロヘキシリメチルノニル、3-シクロペンチルノニル、2-シクロヘキシリノニル、2-シクロヘキシリメチルノニル、1-シクロペンチルデシル、1-シクロペンチルウンデシル、1-シクロヘキシリウンデシル、1-シクロペンチルドデシル、1-シクロペニチルトリデシル、2-シクロペンチルデシル、3-シクロペンチルウンデシル、3-シクロヘキシリウンデシル、2-シクロペンチルドデシル、2-シクロペンチルトリデシル、1-シクロペンチルテトラデシル、1-シクロヘキシリテトラデシル、2-シクロペンチルテトラデシル、3-シクロヘキシリテトラデシルなど。

(7) シクロアルケニルアルキル基：例えば

2-シクロヘキセン-1-イルメチル、1-シクロペントン-1-イルメチル、2-(2-シクロペントン-1-イル)エチル、2-(1-シクロヘキセン-1-イル)エチル、3-(1-シクロペントン-1-イル)プロピル、3-(1-シクロヘキセン-1-イル)プロピル、4-(1-シクロヘキセン-1-イル)ブチル、1-(1-シクロペントン-1-イル)ペンチル、5-(1-シクロペントン-1-イル)ペンチル、1-1(シクロヘキセン-1-イル)ペンチル、5-(1-シクロヘキセン-1-イル)ペンチル、1-(1-シクロヘキセン-1-イルメチル)ペンチル、1-(1-シクロペントン-1-イル)ヘキシル、6-(1-シクロペントン-1-イル)ヘキシル、1-(1-シグロヘキセン-1-イル)ヘキシル、6-(シクロヘキセン-1-イル)ヘキシル、1-(2-シクロペントン-1-イルメチル)ヘキシル、1-(1-シクロペントン-1-イル)ヘプチル、7-(1-シクロペントン-1-イル)

(6)

11

ヘプチル、1-(1-シクロヘキセン-1-イルメチル)ヘプチル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)オクチル、1-(2-シクロペンテン-1-イル)オクチル、1-(2-シクロヘキセン-1-イル)オクチル、8-(2-シクロヘキセン-1-イル)オクチル、1-(1-シクロペンテン-1-イルメチル)オクチル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)ノニル、9-(1-シクロペンテン-1-イル)ノニル、1-(1-シクロヘキセン-1-イル)ノニル、9-(1-シクロヘキセン-1-イルメチル)ノニル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)デシル、10-(1-シクロペンテン-1-イル)デシル、1-(2-シクロペンテン-1-イル)ウンデシル、1-(2-シクロヘキセン-1-イル)ウンデシル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)ドデシル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)トリデシル、1-(2-シクロペンテン-1-イル)テトラデシル、1-(3-シクロヘキセン-1-イル)テトラデシルなど。

(6) アルキルシクロアルキル基及びアルケニルシクロアルキル基：例えば

1-メチルシクロブチル、2-エチルシクロブチル、2-プロピルシクロブチル、1-ブチルシクロブチル、1-ペンチルシクロブチル、1-ヘキシルシクロブチル、1-ヘプチルシクロブチル、1-オクチルシクロブチル、1-ノニルシクロブチル、2-ペンチルシクロブチル、2-ヘキシルシクロブチル、2-ヘプチルシクロブチル、2-オクチルシクロブチル、2-ノニルシクロブチル、1-デシルシクロブチル、1-ウンデシルシクロブチル、1-ドデシルシクロブチル、1-ペンタデシルシクロブチル、1-(9-オクタデセニル)シクロブチル、1-メチルシクロペンチル、2-メチルシクロペンチル、1-エチルシクロペンチル、1-プロピルシクロペンチル、1-ブチルシクロペンチル、2-ペンチルシクロペンチル、1-ヘキシルシクロペンチル、3-ヘキシルシクロペンチル、1-ヘプチルシクロペンチル、1-オクチルシクロペンチル、2-オクチルシクロペンチル、1-デシルシクロペンチル、1-トリアデシルシクロペンチル、1-テトラデシルシクロペンチル、1-(9-オクタデセニル)シクロペンチル、1-メチルシクロヘキシル、1-エチルシクロヘキシル、1-プロピルシクロヘキシル、2-メチルシクロヘキシル、3-エチルシクロヘキシル、4-プロピルシクロヘキシル、1-ブチルシクロヘキシル、1-ペニチルシクロヘキシル、1-ヘキシルシクロヘキシル、4-ブチルシクロヘキシル、4-ヘキシルシクロヘキシル、1-ヘプチルシクロヘキシル、1-オクチルシクロヘキシル、1-ノニルシクロヘキシル、1-ウンデシルシクロヘキシル、1-ヘキサデシルシクロヘキシル、1-(9-オクタデセニル)-2-シクロヘキシルなど。

12

キシル、1-(9-オクタデセニル)シクロヘキシルなど。

(9) アルキルシクロアルケニル基及びアルケニルシクロアルケニル基：例えば

1-メチル-2-シクロペンテニル、1-エチル-2-シクロペンテニル、1-プロピル-2-シクロペンテニル、1-ブチル-2-シクロペンテニル、1-ペンチル-2-シクロペンテニル、1-ヘキシル-2-シクロペンテニル、1-ヘプチル-2-シクロペンテニル、1-オクチル-2-シクロペンテニル、2-メチル-2-シクロペンテニル、3-エチル-2-シクロペンテニル、2-プロピル-3-シクロペンテニル、3-ブチル-2-シクロペンテニル、2-ヘキシル-3-シクロペンテニル、2-ヘプチル-2-シクロペンテニル、2-オクチル-3-シクロペンテニル、1-デシル-2-シクロペンテニル、1-ドデシル-2-シクロペンテニル、1-トリデシル-2-シクロペンテニル、1-テトラデシル-2-シクロペンテニル、1-(9-オクタデセニル)-2-シクロペンテニル、1-メチル-2-シクロヘキセニル、1-エチル-2-シクロヘキセニル、1-プロピル-2-シクロヘキセニル、1-ブチル-2-シクロヘキセニル、1-ペンチル-2-シクロヘキセニル、1-ヘキシル-2-シクロヘキセニル、1-ヘプチル-2-シクロヘキセニル、4-メチル-2-シロヘキセニル、2-エチル-2-シクロヘキセニル、3-プロピル-2-シクロヘキセニル、4-ブチル-3-シクロヘキセニル、3-ペンチル-3-シクロヘキセニル、4-ヘキシル-3-シクロヘキセニル、4-ヘプチル-3-シクロヘキセニル、4-オクチル-2-シクロヘキセニル、1-ノニル-2-シクロヘキセニル、1-ウンデシル-2-シクロヘキセニル、1-ヘキサデシル-2-シクロヘキセニル、1-(9-オクタデセニル)-2-シクロヘキセニルなど。

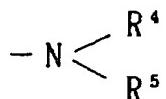
「飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換された一価脂肪族炭化水素基」の「芳香族基」としては、例えば、フェニル、ナフチルの如き芳香族炭化水素基、フリール、チエニル、ピリジン、キノリル、イソキノリル、ピリダジニル、ピラジニル、インドリル、ベンゾオキサジアゾリル、イミダゾリル、ベンゾチアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリルの如き芳香族複素環式基を示すことができる。この芳香族基は置換されていてもよく、例えば、塩素原子、臭素原子、フッ素原子等のハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、トリクロロメチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシ基、フェニル基、フェノキシ基、低級アルキルチオ基等の置換基を挙げることができる。

前記一般式においてはR<sup>3</sup>又はR<sup>4</sup>によって表わされうる飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環

13

状の一価脂肪族炭化水素基としては、上記のうちで、比較的長鎖のもの、すなわち炭素数が5～25個、好ましくは8～22個のものが使用され、一方、F<sub>5</sub>によって表わされうる飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の一価脂肪族炭化水素基は短鎖のもの及び長鎖のもののいずれであってもよいが、一般には比較的短鎖のもの、好ましくは炭素数が1～10、より好ましくは1～8のものが適している。

したて、前記一般式(I)において $\beta^3$ により表わされうる基



の具体例としては、例えば、2-シクロペンチルエチルアミノ、2-シクロヘキシリエチルアミノ、3-シクロペンチルプロビルアミノ、3-シクロヘキシリプロビルアミノ、2-シクロペンチル-1-メチルエチルアミノ、2-シクロペンチル-1,1-ジメチルエチルアミノ、2-シクロヘキシリ-1-メチルエチルアミノ、3-シクロペンチルプロビルアミノ、3-シクロヘキシリプロビルアミノ、4-シクロヘキシリ-1,1-ジメチルブチルアミノ、1-メチルペンチルアミノ、1,1-ジメチルペンチルアミノ、1-エチルペンチルアミノ、1-シクロヘキシリ-4-メチルペンチルアミノ、1-シクロペンチル-4-メチルペンチルアミノ、2-メチルペンチルアミノ、1,2-ジメチルペンチルアミノ、2-エチルペンチルアミノ、2-シクロヘキシリ-4-メチルペンチルアミノ、2-シクロペンチル-4-メチルペンチルアミノ、3-メチルペンチルアミノ、1,3-ジメチルペンチルアミノ、3-エチルペンチルアミノ、1-シクロヘキシリ-3-メチルペンチルアミノ、1-シクロペンチル-3-メチルペンチルアミノ、ヘキシリアミノ、1-メチルヘキシリアミノ、1,1-ジメチルヘキシリアミノ、1-エチルヘキシリアミノ、1,1-ジエチルヘキシリアミノ、1-プロピルヘキシリアミノ、1-ブチルヘキシリアミノ、1-シクロペンチルヘキシリアミノ、2-メチルヘキシリアミノ、1,2-ジメチルヘキシリアミノ、2-エチルヘキシリアミノ、1,2-ジエチルヘキシリアミノ、2-プロピルヘキシリアミノ、2-ブチルヘキシリアミノ、6-シクロペンチルヘキシリアミノ、6-シクロヘキシリヘキシリアミノ、ヘプチルアミノ、1-エチルヘプチルアミノ、1,1-ジメチルヘプチルアミノ、1-シクロヘキシリヘプチルアミノ、1-シクロヘキシリメチルヘプチルアミノ、1-シクロペンチルメチルヘプチルアミノ、オクチルアミノ、1,1-ジメチルオクチルアミノ、1-メチルオクチルアミノ、1-エチルオクチルアミノ、1,1-ジエチルオクチルアミノ、1-プロピルオクチルアミノ、1-ブチルオクチルアミノ、1-シクロペンチルオクチルアミノ、1-シクロヘキシリオクチル

(7)

14

アミノ、1-シクロペンチルメチルオクチルアミノ、1-シクロヘキシルメチルオクチルアミノ、ノニルアミノ、1-メチルノニルアミノ、1,1-ジメチルノニルアミノ、1-エチルノニルアミノ、1,1-ジエチルノニルアミノ、デシリアルアミノ、1-メチルデシリアルアミノ、1,1-ジメチルデシリアルアミノ、1-エチルデシリアルアミノ、1-ジエチルデシリアルアミノ、1-シクロヘキシルデシリアルアミノ、1-シクロヘキシルメチルデシリアルアミノ、1-シクロヘキシルメチルデシリルアミノ、ウンデシリルアミノ、1-メチルウンデシリルアミノ、1,1-ジメチルウンデンシリルアミノ、ドデシリルアミノ、1-メチルドデシリルアミノ、1,1-ジメチルドデシリルアミノ、テトラデシリルアミノ、1-メチルテトラデシリルアミノ、1,1-ジメチルテトラデシリルアミノ、ペンタデシリルアミノ、1-メチルペンタデシリルアミノ、1,1-ジメチルペンタデシリルアミノ、ヘキサデシリルアミノ、1-メチルヘキサデシリルアミノ、1,1-ジメチルヘキサデシリルアミノ、ヘプタデシリルアミノ、1-メチルヘプタデシリルアミノ、1,1-ジメチルヘプタデシリルアミノ、オクタデシリルアミノ、1-メチルオクタデシリルアミノ、1,1-ジメチルオクタデシリルアミノ、3-シクロペンチル-2-プロペニルアミノ、3-シクロヘキシリ-2-プロペニルアミノ、1,1-ジメチル-3-ブテニルアミノ、1-エチル-3-ブテニルアミノ、1-シクロプロピル-3-ブテニルアミノ、1-メチル-2-ペンテニルアミノ、1,1-ジメチル-2-ペンテニルアミノ、1-エチル-2-ペンテニルアミノ、1-シクロプロピル-2-ペンテニルアミノ、2-ヘキセニルアミノ、1-メチル-2-ヘキセニルアミノ、1,1-ジメチル-2-ヘキセニルアミノ、3-ヘキセニルアミノ、1-メチル-3-ヘキセニルアミノ、1,1-ジメチル-3-ヘキセニルアミノ、2-ヘプテニルアミノ、1-メチル-2-ヘプテニルアミノ、2-オクテニルアミノ、1-メチル-2-オクテニルアミノ、3-ノネニルアミノ、1-メチル-3-ノネニルアミノ、1,1-ジメチル-3-ノネニルアミノ、1-エチル-3-ノネニルアミノ、1-プロピル-3-ノネニルアミノ、8-ノネニルアミノ、1-メチル-8-ノネニルアミノ、1,1-ジメチル-8-ノネニルアミノ、1-エチル-8-ノネニルアミノ、9-デセニルアミノ、1-メチル-9-デセニルアミノ、1,1-ジメチル-9-デセニルアミノ、1-エチル-9-デセニルアミノ、6-ウンデセニルアミノ、1-メチル-6-ウンデセニルアミノ、1,1-ジメチル-6-ウンデセニルアミノ、6-トリデセニルアミノ、1-メチル-6-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-6-トリデセニルアミノ、8-トリデセニルアミノ、1-メチル-8-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-トリデセニルアミノ、10-トリデセニルアミノ、1-メチル-10-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-トリデセニルアミノ、10-ペンタデセニルア

(8)

15

ミノ、1-メチル-10-ペンタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-ペンタデセニルアミノ、8-ペンタデセニルアミノ、1-メチル-8-ペンタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-ペンタデセニルアミノ、12-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-12-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニルアミノ、10-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-10-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニルアミノ、8-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-8-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニルアミノ、1-エチル-8-ヘプタデセニルアミノ、8,11-ヘプタデカジエニルアミノ、1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニルアミノ、8,11,14-ヘプタデカトリエニルアミノ、1-エチルシクロブチルアミノ、1-プロピルシクロブチルアミノ、1-ブチルシクロブチルアミノ、1-ペンチルシクロブチルアミノ、1-ヘキシリシクロブチルアミノ、1-ペンチルシクロブチルアミノ、1-オクチルシクロブチルアミノ、1-ノニルシクロブチルアミノ、1-デシルシクロブチルアミノ、1-ウンデシルシクロブチルアミノ、1-ドデシルシクロブチルアミノ、1-ペンタデシルシクロブチルアミノ、1-(9-オクタデセニル)シクロブチルアミノ、1-メチルシクロペンチルアミノ、1-エチルシクロペンチルアミノ、1-プロピルシクロペンチルアミノ、1-ブチルシクロペンチルアミノ、1-ヘキシリシクロペンチルアミノ、1-オクチルシクロペンチルアミノ、1-デシルシクロペンチルアミノ、1-ドデシルシクロペンチルアミノ、1-トリデシルシクロペンチルアミノ、1-テトラデシルシクロペンチルアミノ、1-(9-オクタデセニル)シクロペンチルアミノ、シクロヘキシリアミノ、1-メチルシクロヘキシリアミノ、1-プロピルシクロヘキシリアミノ、1-ペンチルシクロヘキシリアミノ、1-ヘプチルシクロヘキシリアミノ、1-ノニルシクロヘキシリアミノ、1-ウンデシルシクロヘキシリアミノ、1-(9-オクタデセニル)シクロヘキシリアミノなどモノ置換アミノ基；

(2-シクロペンチルエチル)エチルアミノ、(2-シクロペンチルブチル)エチルアミノ、(2-シクロペンチルエチル)オクチルアミノ、(2-シクロヘキシリエチル)プロピルアミノ、(2-シクロヘキシリエチル)ペンチルアミノ、(2-シクロヘキシリエチル)デシルアミノ、(3-シクロペンチルプロピル)ヘプチルアミノ、(3-シクロヘキシリプロピル)オクチルアミノ、ブチル(2-シクロペンチル-1-メチルエチル)アミノ、(2-シクロベンチル-1,1-ジメチルエチル)ヘキシリアミノ、(2-シクロヘキシリ-1-メチルエチル)デシルアミノ、(3-シクロベンチルプロピル)ヘキシリアミノ、(3-シクロヘキシリプロピル)オクチルアミノ、(4-シクロヘキシリ-1,1-ジメチルブチ

16

ル)ペニチルアミノ、ヘキシリ(1-メチルペニチル)アミノ、(1,1-ジメチルペニチル)ヘプチルアミノ、デシル(1-エチルペニチル)アミノ、ブチル(1-シクロヘキシリ-4-メチルペニチル)アミノ、(1-シクロペニチル-4-メチルペニチル)ペニチルアミノ、デシル(2-メチルペニチル)アミノ、(1,2-ジメチルペニチル)ヘプチルアミノ、ドデシル(2-エチルペニチル)アミノ、ブチル(2-シクロヘキシリ-4-メチルペニチル)アミノ、(2-シクロペニチル-4-メチルペニチル)プロピルアミノ、(3-メチルペニチル)オクチルアモノ、(1,3-ジメチルペニチル)ヘプチルアミノ、(3-エチルペニチル)ノニルアミノ、ブチル(1-シクロヘキシリ-3-メチルペニチル)アミノ、(1-シクロペニチル-3-メチルペニチル)プロピルアミノ、ジヘキシリアミノ、ブチルヘキシリアミノ、ヘキシリオクチルアミノ、デシルヘキシリアミノ、(1-メチルヘキシリ)ペニチルアミノ、デシル(1,1-ジメチルヘキシリ)アミノ、(1-エチルヘキシリ)ウンデシルアミノ、(1,1-ジエチルヘキシリ)オクチルアミノ、ヘプチル(1-プロピルヘキシリ)アミノ、(1-ブチルヘキシリ)プロピルアミノ、ブチル(1-シクロペニチルヘキシリ)アミノ、(2-メチルヘキシリ)オクチルアミノ、デシル(1,2-ジメチルヘキシリ)アミノ、(2-エチルヘキシリ)テトラデシルアミノ、(1,2-ジエチルヘキシリ)オクチルアミノ、ドデシル(2-プロピルヘキシリ)アミノ、(2-ブチルヘキシリ)オクチルアミノ、ブチル(6-シクロペニチルヘキシリ)アミノ、(6-シクロヘキシリヘキシリ)プロピルアミノ、ジヘプチルアミノ、(1-エチルヘプチル)トリデシルアミノ、(1,1-ジメチルヘプチル)ペニチルアミノ、(1-シクロヘキシリヘプチル)ペニチルアミノ、(1-シクロペニチルヘプチル)ヘキシリアミノ、ブチル(1-シクロヘキシリメチルヘプチル)アミノ、(1-シクロペニチルメチルヘプチル)プロピルアミノ、オクチルプロピルアミノ、ヘキシリオクチルアミノ、(1,1-ジメチルオクチル)ペニチルアミノ、ヘキシリ(1-メチルオクチル)アミノ、(1-エチルオクチル)ペニチルアミノ、ブチル(1,1-ジエチルオクチル)アミノ、オクチル(1-プロピルオクチル)アミノ、(1-ブチルオクチル)ヘキシリアミノ、(1-シクロペンチルオクチル)ペニチルアミノ、ブチル(1-シクロヘキシリオクチル)アミノ、(1-シクロペニチルメチルオクチル)プロピルアミノ、(1-シクロヘキシリメチルオクチル)プロピルアミノ、ノニルプロピルアミノ、(1-メチルノニル)ヘプチルアミノ、(1,1-ジメチルノニル)ヘキシリアミノ、ブチル(1-エチルノニル)アミノ、(1,1-ジエチルノニル)プロピルアミノ、デシルエキシリアミノ、(1-メチルデシル)ペニチルアミノ、(1,1-ジメチルデシル)ヘキシリアミノ、ブチル(1-エチルデシル)アミノ、(1,1-ジ

(9)

17

エチルデシル) ペンチルアミノ、ブチル (1-シクロペンチルデシル) アミノ、(1-シクロヘキシルデシル) プロピルアミノ、(1-シクロペンチルメチルデシル) エチルアミノ、(1-シクロヘキシルメチルデシル) メチルアミノ、ブチルウンデシルアミノ、(1-メチルウンデシル) プロピルアミノ、(1,1-ジメチルウンデシル) プロピルアミノ、ブチルドデシルアミノ、(1-メチルドデシル) プロピルアミノ、(1,1-ジメチルドデシル) プロピルアミノ、プロピルテトラデシルアミノ、ブチル (1-メチルテトラデシル) アミノ、(1,1-ジメチルテトラデシル) プロピルアミノ、ブチルペンタデシルアミノ、ブチル (1-メチルペンタデシル) アミノ、(1,1-ジメチルペンタデシル) プロピルアミノ、エチルヘキサデシルアミノ、エチル (1-メチルヘキサデシル) アミノ、(1,1-ジメチルヘキサデシル) メチルアミノ、ヘプタデシルメチルアミノ、(1-メチルヘプタデシル) メチルアミノ、(1,1-ジメチルヘプタデシル) メチルアミノ、メチルオクタデシルアミノ、エチル (1-メチルオクタデシル) アミノ、(1,1-ジメチルオクタデシル) エチルアミノ、(3-シクロペンチル-2-プロペニル) ヘキシルアミノ、(3-シクロヘキシル-2-プロペニル) ヘプチルアミノ、(1,1-ジメチル-3-ブテニル) オクチルアミノ、(1-エチル-3-ブテニル) ノイルアミノ、(1-シクロプロビル-3-ブテニル) デシルアミノ、(1-メチル-2-ペンテニル) デシルアミノ、(1,1-ジメチル-2-ペンテニル) ノイルアミノ、デシル (1-エチル-2-ペンテニル) アミノ、(1-シクロプロビル-2-ペンテニル) ヘプチルアミノ、(2-ヘキセニル) オクチルアミノ、(1-メチル-2-ヘキセニル) ペンチルアミノ、デシル (1,1-ジメチル-2-ヘキセニル) アミノ、ブチル (3-ヘキセニル) アミノ、(1-メチル-3-ヘキセニル) オクテニルアミノ、(1,1-ジメチル-3-ヘキセニル) オクテニルアミノ、ジ (2-ヘプテニル) アミノ、(1-メチル-2-ヘプテニル) ヘプチルアミノ、(2-オクテニル) ペンチルアミノ、(1-メチル-2-オクテニル) ヘキシルアミノ、ヘプチル (3-ノネニル) アミノ、ヘキシル (1-メチル-3-ノネニル) アミノ、(1,1-ジメチル-3-ノネニル) ヘキシルアミノ、(1-エチル-3-ノネニル) ペンチルアミノ、ブチル (1-プロビル-3-ノネニル) アミノ、(8-ノネニル) ペンチルアミノ、(1-メチル-8-ノネニル) ペンチルアミノ、ブチル (1,1-ジメチル-8-ノネニル) アミノ、(1-エチル-8-ノネニル) ペンチルアミノ、(9-デセニル) プロピルアミノ、(1-メチル-9-デセニル) ペンチルアミノ、ブチル (1,1-ジメチル-9-デセニル) アミノ、(1-エチル-9-デセニル) プロピルアミノ、ペンチル (6-ウンデセニル) アミノ、ブチル (1-メチル-6-ウンデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-6-ウンデセニル)

18

ル) プロピルアミノ、ペンチル (6-トリデセニル) アミノ、(1-メチル-6-トリデセニル) ペンチルアミノ、(1,1-ジメチル-6-トリデセニル) エチルアミノ、ブチル (8-トリデセニル) アミノ、ブチル (1-メチル-8-トリデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-8-トリデセニル) エチルアミノ、エチル (10-トリデセニル) アミノ、ブチル (1-メチル-10-トリデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-10-トリデセニル) プロピルアミノ、ブチル (10-ペンタデセニル) アミノ、ブチル (1-メチル-10-ペンタデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-10-ペンタデセニル) プロピルアミノ、(8-ペンタデセニル) プロピルアミノ、(1-メチル-8-ペンタデセニル) プロピルアミノ、エチル (1,1-ジメチル-8-ペンタデセニル) アミノ、ブチル (12-ヘプタデセニル) アミノ、エチル (1-メチル-12-ヘプタデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニル) プロピルアミノ、エチル (10-ヘプタデセニル) アミノ、(1-メチル-10-ヘプタデセニル) プロピルアミノ、(1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニル) エチルアミノ、(8-ヘプタデセニル) メチルアミノ、メチル (1-メチル-8-ヘプタデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル) エチルアミノ、(1-エチル-8-ヘプタデセニル) プロピルアミノ、(8,11-ヘプタデカジエニル) メチルアミノ、メチル (1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニル) アミノ、(8,11,14-ヘプタデカトリエニル) メチルアミノ、(1-エチルシクロブチル) ペンチルアミノ、ヘプチル (1-プロビルシクロブチル) アミノ、(1-ブチルシクロブチル) ヘキシルアミノ、ブチル (1-ペンチルシクロブチル) アミノ、ヘプチル (1-ヘキシルシクロブチル) アミノ、(1-ペンチルシクロブチル) プロピルアミノ、エチル (1-オクチルシクロブチル) アミノ、プロピル (1-ノイルシクロブチル) アミノ、(1-デシルシクロブチル) エチルアミノ、メチル (1-ウンデシルシクロブチル) アミノ、(1-ドデシルシクロブチル) メチルアミノ、エチル (1-ペントデシルシクロブチル) アミノ、メチル {1- (9-オクタデセニル) シクロブチル} アミノ、メチル (1-メチルシクロペンチル) アミノ、(1-エチルシクロペンチル) プロピルアミノ、プロピル (1-プロビルシクロペンチル) アミノ、(1-ブチルシクロペンチル) ペンチルアミノ、(1-ヘキシルシクロペンチル) メチルアミノ、メチル (1-オクチルシクロペンチル) アミノ、(1-デシルシクロペンチル) メチルアミノ、(1-ドデシルシクロペンチル) メチルアミノ、メチル (1-トリデシルシクロペンチル) アミノ、メチル (1-テトラデシルシクロペンチル) アミノ、メチル {1- (9-オクタデセニル) シクロペンチル} アミノ、シクロヘキシルオクチルアミノ、ヘプチル (1-メチルシクロヘキシル) アミノ、ヘキシル (1-プロビルシクロヘキシル) アミ

(10)

19

ノ、ヘキシル（1-ペンチルシクロヘキシル）アミノ、ペンチル（1-ヘプチルシクロヘキシル）アミノ、ブチル（1-ノニルシクロヘキシル）アミノ、エチル（1-ウンデシルシクロヘキシル）アミノ、エチル（1-ヘキサデシルシクロヘキシル）アミノ、メチル〔1-（9-オクタデセニル）シクロヘキシル〕アミノ、ベンジルヘキシルアミノ、ベンジルヘプチルアミノ、ベンジルオクチルアミノ、ベンジルデシルアミノ、ベンジルノニルアミノ、ベンジルウンデシルアミノ、ノニル（2-フェニルエチル）アミノ、ノニル（4-フェニルブチル）アミノ、4-ネオペンチルベンジルノニルアミノ、4-イソプロピルベンジルノニルアミノ、ヘプチル（4-ネオペンチルベンジル）アミノなどのジ置換アミノ基が挙げられる。

また、「飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の二価脂肪族炭化水素基」としては以下に例示するものを挙げることができる。

(1) アルキレン基及びシクロアルキルアルキレン基、例えば、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン、ヘプタメチレン、オクタメチレン、ノナメチレン、デカメチレン、プロピレン、エチルエチレン、イソプロピルエチレン、プロピルエチレン、ブチルエチレン、イソブチルエチレン、シクロペンチルエチレン、シクロヘキシリエチレン、シクロヘプチルエチレン、1,1-ジメチルエチレン、1-メチルトリメチレン、2-メチルトリメチレン、1-エチルトリメチレン、1-イソプロピルトリメチレン、1-イソブチルトリメチレン、1-シクロペンチルトリメチレン、1-シクロヘキシリトリメチレン、2-イソプロピルトリメチレン、2-イソブチルトリメチレン、2-シクロヘキシリトリメチレン、1-メチルテトラメチレン、1-イソプロピルテトラメチレン、1-イソブチルテトラメチレン、1-シクロペンチルテトラメチレン、1-シクロヘキシリテトラメチレン、2-メチルテトラメチレン、2-イソプロピルテトラメチレン、2-イソブチルテトラメチレン、2-シクロペンチルテトラメチレン、2-シクロヘキシリテトラメチレン、1-メチルペンタメチレン、1-エチルペンタメチレン、1-イソプロピルペンタメチレン、1-イソブチルペンタメチレン、1-シクロペンチルペンタメチレン、1-シクロヘキシリペンタメチレン、2-メチルペンタメチレン、2-エチルペンタメチレン、2-イソプロピルペンタメチレン、2-イソブチルペンタメチレン、2-シクロペンチルペンタメチレン、2-シクロヘキシリペンタメチレン、メチルペンタメチレン、3-エチルペンタメチレン、3-イソプロピルペンタメチレン、3-イソブチルペンタメチレン、3-シクロペンチルペンタメチレン、3-シクロヘキシリペンタメチレン、1-メチルヘキサメチレン、1-エチルヘキサメチレン、1-イソプロピルヘキサメチレン、1-イソブチルヘキサメチレン、1-

20

一シクロペンチルヘキサメチレン、1-シクロヘキシルヘキサメチレン、2-メチルヘキサメチレン、2-エチルヘキサメチレン、2-イソプロピルヘキサメチレン、2-イソブチルヘキサメチレン、2-シクロペンチルヘキサメチレン、2-シクロヘキシルヘキサメチレン、3-メチルヘキサメチレン、3-エチルヘキサメチレン、3-イソプロピルヘキサメチレン、3-イソブチルヘキサメチレン、3-シクロペンチルヘキサメチレン、3-シクロヘキシルヘキサメチレン、1-メチルヘプタメチレン、1-エチルヘプタメチレン、1-イソプロピルヘプタメチレン、1-イソブチルヘプタメチレン、1-シクロペンチルヘプタメチレン、1-シクロヘキシルヘプタメチレン、2-メチルヘプタメチル、2-エチルヘプタメチレン、2-イソプロピルヘプタメチレン、2-シクロペンチルヘプタメチレン、2-シクロエキシルヘプタメチレン、3-メチルヘプタメチレン、3-エチルヘプタメチレン、3-イソプロピルヘプタメチレン、3-イソブチルヘプタメチレン、3-シクロペンチルヘプタメチレン、3-シクロヘキシルヘプタメチレン、1-メチルオクタメチレン、1-エチルオクタメチレン、1-イソプロピルオクタメチレン、1-イソブチルオクタメチレン、1-シクロペニチルオクタメチレン、1-シクロヘキシルオクタメチレン、2-メチルオクタメチレン、2-エチルオクタメチレン、2-イソプロピルオクタメチレン、2-イソブチルオクタメチレン、2-シクロペンチルオクタメチレン、2-シクロヘキシルオクタメチレン、3-メチルオクタメチレン、3-エチルオクタメチレン、3-イソプロピルオクタメチレン、3-イソブチルオクタメチレン、3-シクロペンチルオクタメチレン、3-シクロヘキシルオクタメチレン、1-メチルノナメチレン、1-エチルノナメチレン、1-イソブチルノナメチレン、1-シクロペンチルノナメチレン、1-シクロヘキシルノナメチレン、2-メチルノナメチレン、2-エチルノナメチレン、2-イソプロピルノナメチレン、2-イソブチルノナメチレン、2-シクロペンチルノナメチレン、2-シクロヘキシルノナメチレン、3-メチルノナメチレン、3-エチルノナメチレン、3-イソブチルノナメチレン、3-イソプロピルノナメチレン、3-イソブチルノナメチレン、3-シクロペンチルノナメチレン、3-シクロヘキシルノナメチレン、1-メチルデカメチレン、1-エチルノデカチレン、1-イソプロピルデカメチレン、1-イソブチルデカメチレン、1-シクロペニチルデカメチレン、1-シクロヘキシルデカメチレン、2-メチルデカメチレン、2-エチルデカメチレン、2-イソプロピルデカメチレン、2-イソブチルデカメチレン、2-シクロペンチルデカメチレン、2-シクロヘキシルデカメチレン、3-メチルデカメチレン、3-エチルデカメチレン、3-イソブチルデカメチレン、3-イソプロピルデカメチレン、3-イソブチルデカメチレン、3-シクロペンチル

(11)

21

デカメチレン、3-シクロヘキシルデカメチレンなどのC<sub>2</sub>~C<sub>16</sub>アルキレン基及びC<sub>5</sub>~C<sub>7</sub>シクロアルキル-C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>アルキレン基。

(2) シクロアルキレン基：例えば1,2-シクロペンチレン、1,3-シクロペンチレン、1,2-シクロヘキシレン、1,3-シクロヘキシレン、1,4-シクロヘキシレン、1,2-シクロヘプチレン、1,3-シクロヘプチレン、1,4-シクロヘプチレンなどC<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキレン基。

(3) アルケニレン基及びアルキニレン基：例えば2-ブテニレン、1-メチル-2-ブテニレン、1-エチル-2-ブテニレン、2-プロピルブテニレン、1-ブチルブテニレン、2-ブチニレン、2-ペンテニレン、2-ベンチニレン、2-ヘキセニレン、3-ヘキセニレン、2-ヘキシニレン、3-ヘキシニレン、2-ヘブテニレン、3-ヘブテニレン、2-ヘブチニレン、2-オクテニレン、4-オクテニレンなどのC<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>アルケニレン基及びC<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>アルキニレン基。

(4) シクロアルキレンアルキレン基：例えば1,1-ペントラメチレンエチレン、1,1-テトラメチレンエチレン、1,1-ヘキサメチレンエチレン、1,1-テトラメチレントリメチレン、1,1-ペントラメチレントリメチレン、1,2-トライメチレントリメチレン、1,2-テトラメチレントリメチレン、1,1-トライメチレンペントラメチレン、1,1-テトラメチレンペントラメチレン、1,1-ペントラメチレンペントラメチレン、1,2-トライメチレンペントラメチレン、1,2-ペントラメチレンペントラメチレン、1,3-トライメチレンペントラメチレン、1,1-トライメチレンヘキサメチレン、1,1-テトラメチレンヘキサメチレン、1,1-ペントラメチレンヘキサメチレン、1,2-トライメチレンヘキサメチレン、1,2-テトラメチレンヘキサメチレン、1,2-ペントラメチレンヘキサメチレン、1,3-トライメチレンヘキサメチレン、1,1-トライメチレンヘプタメチレン、1,1-テトラメチレンヘプタメチレン、1,1-ペントラメチレンヘプタメチレン、1,2-トライメチレンヘプタメチレン、1,2-テトラメチレンヘプタメチレン、1,2-ペントラメチレンヘプタメチレン、1,3-トライメチレンヘプタメチレン、1,1-トライメチレンオクタメチレン、1,1-テトラメチレンオクタメチレン、1,1-ペントラメチレンオクタメチレン、1,2-トライメチレンオクタメチレン、1,2-テトラメチレンオクタメチレン、1,2-ペントラメチレンオクタメチレン、1,3-トライメチレンオクタメチレン、1,1-トライメチレンノナメチレン、1,1-テトラメチレンノナメチレン、1,1-ペントラメチレンノナメチレン、1,2-トライメチレンノナメチレン、1,2-ペントラメチレンノナメチレン、1,3-トライメチレンノナメチレン、1,1-トライメチレンデカメチレン、1,1-テトラメチレンデカメチレン、1,1-ペントラメチレンデカメチレン、1,2-トライメチレンデカメチレン、1,2-テトラメチレンデカメチレン、1,3-ペントラメチレンデカメチ

(11)

22

レン、1,3-トライメチレンデカメチレンなどのC<sub>4</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキレン-C<sub>1</sub>~C<sub>7</sub>アルキレン基。

上記の如き二価脂肪族炭化水素基はさらに、芳香族基例えば、フェニル、ナフチルなどのアリール基；フリル、チエニル、ビリジル、インドリルなどのヘテロアリール基で置換されていてもよく、そのように置換された二価脂肪族炭化水素基の例としては、フェニルエチレン、ナフチルエチレン、フリルエチレン、チエニルエチレン、ビリジルエチレン、ベンジルエチレン、ナフチルメチルエチレン、フリルメチルエチレン、チエニルメチルエチレン、ビリジルメチルエチレン、インドリルメチルエチレンなどが挙げられる。

「二価芳香族炭化水素基」としては単環式又は多環式のいずれであってもよく、例えば、フェニレンナフチレン等が挙げられ、これらは芳香環が1~4個の低級アルキル基で置換されていてもよい。

さらに「二価芳香族複素環式基」には、ヘテロ原子として窒素、酸素、イオン原子より選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を環中に含む芳香族性不飽和をもつ複素環式基が含まれ、該複素環式基はさらに上記の如き芳香族炭化水素環と縮合環を形成していてもよい。そのような二価芳香族複素環式基の具体例を示せば次にとおりである。ピリジンジイル、ピリミジンジイル、ピリダジンジイル、ピラジンジイル、フランジイル、チオフェンジイル、キノリンジイル、イソキノリンジイル、ベンゾフランジイル、ベンゾチオフェンジイル、ベンズオキサゾールジイル、ベンズチアゾールジイル、インドールジイルなど。

本発明により提供される化合物中、好適なものとしては、前記一般式(I)において、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は同一もしくは相異なり、各々、水素原子；低級アルキル基、特にt-ブチル基；ハロゲン原子、低級アルコキシ基、ニトロ基もしくはシアノ基で置換されていてもよいベンジル基、特にベンジル、p-メトキシベンジル、o-ニトロベンジル、p-ニトロベンジル、p-クロロベンジル、o-クロロベンジル、p-シアノベンジル基；ジフェニルメチル基；アリル基；シンナミル基；

テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、4-メトキシテトラヒドロピラニル、4-メトキシテトラヒドロチオピラニル、テトラヒドロフラニル及びテトラヒドロチオフラニルより選ばれる複素環式基；又はアシリル基、特にアセチル、プロピオニル、フェニルアセチル、クロロジフェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、3-ベンゾイルプロピオニル、イソブチロイル、ビバロイル、2-ブテノイル、(E)-2-メチル-2-ブテノイル、ベンゾイル、2-クロロベンゾイル、3-ニトロベンゾイル、2-フルオロベンゾイル、3-トリフルオロメチルベンゾイル、3-トリアクロロメチルベンゾイル、4-フェニルベンゾイル、2,4,6-トリメチ

(12)

23

ルベンゾイル、 $\alpha$ -ナフトイルを表わすか、或いは  
 $R^1$ と $R^2$ は一緒になって1-t-ブチルエチリデン、1-フェニルエチリデン、イソプロピリデン、ブチリデン、シクロペンチリデン、シクロヘキシリデン、シクロヘプチリデン、ベンジリデン、p-メトキシベンジリデン、2,4-ジメトキシベンジリデン、p-ジメチルアミノベンジリデン及びo-ニトロベンジリデンより選ばれるイリデン基を表わし、  
 $R^3$ は

(1) 直鎖状もしくは1位に分岐鎖を有する $C_5 \sim C_{25}$ アルキル基、特にペンチル、1-イソプロピルペンチル、1-t-ブチルペンチル、ヘキシル、1-イソプロピルヘキシル、1-t-ブチルヘキシル、ヘプチル、1-イソプロピルヘプチル、1-t-ブチルヘプチル、オクチル、1-t-ブチルオクチル、ノニル、1-イソブチルノニル、デシル、1-エチルデシル、1,1-ジエチルデシル、1-t-ブチルデシル、ウンデシル、1-イソプロピルウンデシル、1,1-ジエチルウンデシル、ドデシル、1-t-ブチルドデシル、1-イソプロピルドデシル、1,1-ジエチルドデシル、トリデシル、1,1-ジエチルトリデシル、1-t-ブチルトリデシル、テトラデシル、1-イソブチルテトラデシル、ペンタデシル、1-メチルペンタデシル、1,1-ジメチルペンタデシル、1-エチルペンタデシル、1,1-ジエチルペンタデシル、1-イソプロピルペンタデシル、1-t-ブチルペンタデシル、ヘキサデシル、1,1-ジメチルヘキサデシル、1-メチルヘキサデシル、1-エチルヘキサデシル、1-イソプロピルヘキサデシル、1-t-ブチルヘキサデシル、ヘプタデシル、1-メチルヘプタデシル、1,1-ジメチルヘプタデシル、1-エチルヘプタデシル、1-イソプロピルヘプタデシル、1-t-ブチルヘプタデシル、オクタデシル、1-メチルオクタデシル、1,1-ジメチルオクタデシル、1-エチルオクタデシルもしくは1,1-ジエチルオクタデシル基；

(2) 直鎖状もしくは1位に分岐鎖を有する $C_{12} \sim C_{16}$ アルケニル基、特に、1,1-ジメチル-9-デセニル、1-エチル-9-デセニル、1-メチル-6-ウンデセニル、1,1-ジメチル-6-ウンデセニル、6-トリデセニル、1-メチル-6-トリデセニル、1,1-ジメチル-6-トリデセニル、8-トリデセニル、1-メチル-8-トリデセニル、1,1-ジメチル-8-トリデセニル、10-トリデセニル、1-メチル-10-トリデセニル、10-ペンタデセニル、1-メチル-10-ペンタデセニル、1,1-ジメチル-10-ペンタデセニル、8-ペンタデセニル、1-メチル-8-ペンタデセニル、1,1-ジメチル-8-ペンタデセニル、12-ヘプタデセニル、1-メチル-12-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニル、10-ヘプタデセニル、1-メチル-10-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニル、8-ヘプ

24

タデセニル、1-メチル-8-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル、1-エチル-8-ヘプタデセニル、8,11-ヘプタデカジエニル、1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニルもしくは8,11,14-ヘプタデカトリエニル基；

(3)  $C_8 \sim C_{18}$ -アルキル- $C_4 \sim C_6$ シクロアルキル基、特に、1-オクチルシクロブチル、1-ノニルシクロブチル、1-デシルシクロブチル、1-ウンデシルシクロブチル、1-ドデシルシクロブチル、1-ペンタデシルシクロブチル、1-(9-オクタデセニル)シクロブチル、1-オクチルシクロペンチル、1-デシルシクロペンチル、1-ドデシルシクロペンチル、1-トリデシルシクロペンチル、1-テトラデシルシクロペンチル、1-(9-オクタデセニル)シクロペンチル、1-ノニルシクロヘキシル、1-ウンデシルシクロヘキシル、1-ヘキサデシルシクロヘキシルもしくは1-(9-オクタデセニル)シクロヘキシル基；或いは

(4) アルキル基又はアルケニル基でモノ-又はジ-置換された炭素数の合計が8~20のアミノ基、例えば1-イソプロピルペンチルアミノ、1-t-ブチルペンチルアミノ、1-イソプロピルヘキシルアミノ、1-t-ブチルヘキシルアミノ、1-イソプロピルヘプチルアミノ、1-t-ブチルオクチルアミノ、1-イソブチルノニルアミノ、デシルアミノ、1-エチルデシルアミノ、1,1-ジエチルデシルアミノ、1-t-ブチルデシルアミノ、ウンデシルアミノ、1-イソプロピルウンデシルアミノ、1,1-ジエチルウンデシルアミノ、ドデシルアミノ、1-t-ブチルドデシルアミノ、1-イソプロピルドデシルアミノ、1,1-ジエチルドデシルアミノ、トリデシルアミノ、1,1-ジエチルトリデシルアミノ、1-t-ブチルトリデシルアミノ、テトラデシルアミノ、1-イソブチルテトラデシルアミノ、ペンタデシルアミノ、1-メチルペンタデシルアミノ、1,1-ジメチルペンタデシルアミノ、1-エチルペンタデシルアミノ、1,1-ジエチルペンタデシルアミノ、1-イソプロピルペンタデシルアミノ、1-t-ブチルペンタデシルアミノ、ヘキサデシルアミノ、1,1-ジメチルヘキサデシルアミノ、1-メチルヘキサデシルアミノ、1-エチルヘキサデシルアミノ、1-イソブチルヘキサデシルアミノ、1-t-ブチルヘキサデシルアミノ、ヘプタデシルアミノ、1-メチルヘプタデシルアミノ、1,1-ジメチルヘプタデシルアミノ、1-エチルヘプタデシルアミノ、1-イソプロピルヘプタデシルアミノ、1-t-ブチルヘプタデシルアミノ、オクタデシルアミノ、1-メチルオクタデシルアミノ、1,1-ジメチルオクタデシルアミノ、1-エチルオクタデシルアミノ、1,1-ジエチルオクタデシルアミノ、1,1-ジメチル-9-デセニルアミノ、1-エチル-9-デセニルアミノ、1-メチル-6-ウンデセニルアミノ、1,1-ジメチル-6-ウンデセニルアミノ、1-メチル-

(13)

25

6-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-6-トリデセニルアミノ、8-トリデセニルアミノ、1-メチル-8-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-トリデセニルアミノ、10-トリデセニルアミノ、1-メチル-10-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-トリデセニルアミノ、10-ペンタデセニルアミノ、1-メチル-10-ペンタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-ペンタデセニルアミノ、8-ペンタデセニルアミノ、1-メチル-8-ペンタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-ペンタデセニルアミノ、12-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-12-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニルアミノ、10-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-10-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニルアミノ、8-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-8-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニルアミノ、1-エチル-8-ヘプタデセニルアミノ、8,11-ヘプタデカジエニルアミノ、1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニルアミノ、8,11,14-ヘプタデカトリエニルアミノ、1-ヘキシルシクロプロチルアミノ、1-ヘプチルシクロプロチルアミノ、1-オクチルシクロプロチルアミノ、1-ノニルシクロプロチルアミノ、1-デシルシクロプロチルアミノ、1-ウンデシルシクロプロチルアミノ、1-ドデシルシクロプロチルアミノ、1-ペントデシルシクロプロチルアミノ、1-(9-オクタデセニル)シクロプロチルアミノ、1-ペンチルシクロベンチルアミノ、1-ヘキシルシクロベンチルアミノ、1-ヘプチルシクロベンチルアミノ、1-オクチルシクロベンチルアミノ、1-デシルシクロベンチルアミノ、1-ドデシルシクロベンチルアミノ、1-トリデシルシクロベンチルアミノ、1-テトラデシルシクロベンチルアミノ、1-(9-オクタデセニル)シクロベンチルアミノ、1-ノニルシクロヘキシリルアミノ、1-ウンデシルシクロヘキシリルアミノ、1-ヘキサデシルシクロヘキシリルアミノ、1-(9-オクタデセニル)シクロヘキシリルアミノ、デシルヘキシリルアミノ、オクチルプロピルアミノ、ヘキシリルオクチルアミノ、(1-ブチルオクチル)ヘキシリルアミノ、デシルヘキシリルアミノ、ブチル(1-エチルデシル)アミノ、(1,1-ジエチルデシル)ペンチルアミノ、ブチルウニデシルアミノ、ブチルドデシルアミノ、プロピルテトラデシルアミノ、ブチルペンタデシルアミノ、ブチル(1-メチルペンタデシル)アミノ、(1,1-ジメチルペンタデシル)プロピルアミノ、エチルヘキサデシルアミノ、エチル(1-メチルヘキサデシル)アミノ、(1,1-ジメチルヘキサデシル)メチルアミノ、ヘプタデシルメチルアミノ、メチル(1-メチルヘプタデシル)アミノ、(1,1-ジメチルヘプタデシル)メチルアミノ、メチルオクタデシルアミノ、エチル(1-メチルオクタデシル)アミノ、(1,1-ジメチルオクタデシル)エチルアミノ、ブチル(1,1-ジメチル-9-デセニル)アミ

26

ノ、(1-エチル-9-デセニル)プロピルアミノ、ペニチル(6-ウンデセニル)アミノ、ブチル(1-メチル-6-ウンデセニル)アミノ、(1,1-ジメチル-6-ウンデセニル)プロピルアミノ、ペニチル(6-トライデセニル)アミノ、(1-メチル-6-トライデセニル)ペニチルアミノ、(1,1-ジメチル-6-トライデセニル)エチルアミノ、ブチル(8-トライデセニル)アミノ、ブチル(1-メチル-8-トライデセニル)アミノ、(1,1-ジメチル-8-トライデセニル)エチルアミノ、エチル(10-トライデセニル)アミノ、ブチル(1-メチル-10-トライデセニル)アミノ、(1,1-ジメチル-10-トライデセニル)プロピルアミノ、ブチル(10-ペンタデセニル)アミノ、ブチル(1-メチル-10-ペンタデセニル)アミノ、(1,1-ジメチル-10-ペンタデセニル)プロピルアミノ、(8-ペンタデセニル)プロピルアミノ、(1-メチル-8-ペンタデセニル)プロピルアミノ、(1,1-ジメチル-8-ペンタデセニル)エチルアミノ、ブチル(12-ヘプタデセニル)アミノ、エチル(1-メチル-12-ヘプタデセニル)アミノ、(1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニル)プロピルアミノ、エチル(10-ヘプタデセニル)アミノ、(1-メチル-10-エプタデセニル)プロピルアミノ、エチル(1,1-ジメチル-10-エプタデセニル)プロピルアミノ、(8-エプタデセニル)プロピルアミノ、(1-メチル-8-エプタデセニル)プロピルアミノ、(1,1-ジメチル-8-エプタデセニル)エチルアミノ、メチル(1-メチル-8-ヘプタデセニル)アミノ、エチル(1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル)アミノ、(1-エチル-8-ヘプタデセニル)プロピルアミノ、(8,11-ヘプタデカジエニル)メチルアミノ、メチル(1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニル)アミノ、メチル(8,11,14-ヘプタデカトリエニル)アミノなどを表わし、

Aは、

(1) 直鎖状もしくは分岐鎖のC<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>アルキレン基、例えば、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペニタメチレン、ヘキサメチレン、ヘプタメチレン、オクタメチレン、ノナメチレン、デカメチレン、プロピレン、エチルエチレン、イソプロピルエチレン、プロピルエチレン、ブチルエチレン、イソブチルエチレン、1-メチルトリメチレン、1-エチルトリメチレン、1-イソプロピルトリメチレン、1-イソブチルトリメチレン、1-メチルテトラメチレン、1-イソプロピルテラメチレンもしくは1-イソブチルテトラメチレン；  
 (2) C<sub>5</sub>~C<sub>7</sub>シクロアルキル-C<sub>2</sub>~C<sub>5</sub>アルキレン基、例えば、シクロペンチルエチレン、シクロヘキシリルエチレン、シクロヘプチルエチレン、1-シクロペンチルトリメチレン、1-シクロヘキシリルトリメチレン、1-シクロペンチルテトラメチレンもしくは1-シクロヘキシリルテトラメチレン；  
 (3) C<sub>5</sub>~C<sub>7</sub>シクロアルキレン基、例えば、1,2-シクロペンチレン、1,3-シクロペンチレン、1,2-シクロヘキシレン、1,3-シクロヘキシレン、1,4-シクロヘキシ

(14)

27

レン、1,2-シクロヘプチレン、1,3-シクロヘプチレンもしくは1,4-シクロヘプチレン；

(4) C<sub>4</sub>~C<sub>8</sub>アルケニレンもしくはC<sub>4</sub>~C<sub>8</sub>アルキニレン基、例えば、2-ブテニレン、1-メチル-2-ブテニレン、1-エチル-2-ブテニレン、1-プロビルブテニレン、1-ブチルブテニレン、2-ブチニレン、2-ペンテニレン、2-ペンチニレン、2-ヘキセニレン、3-ヘキセニレン、2-ヘキシニレン、3-ヘキシニレン、2-ヘプテニレン、3-ヘプテニレン、2-ヘプチニレン、3-ヘプチニレン、2-オクテニレンもしくは4-オクテニレン；

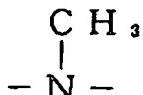
(5) C<sub>5</sub>~C<sub>7</sub>シクロアルキレン-C<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルキレン基、例えば、1,1-ペンタメチレンエチレン、1,1-テトラメチレンエチレン、1,1-ヘキサメチレンエチレン、1,1-ジメチルエチレン、1,1-テトラメチレントリメチレン、1,1-ペンタメチレントリメチレン、1,2-トリメチレントリメチレンもしくは1,2-テトラメチレントリメチレン；

(6) アリールもしくはヘテロアリール基で置換されたC<sub>2</sub>~C<sub>5</sub>アルキレン基、例えば、フェニルエチレン、ナフチルエチレン、フリルエチレン、チエニルエチレン、ビリジルエチレン、ベンジルエチレン、ナフチルメチルエチレン、フリルメチルエチレン、チエニルメチルエチレン、ビリジルメチルエチレン、インドリルメチルエチレン；或いは

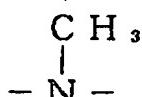
(7) o-フェニレン、m-フェニレン又はp-フェニレン

を表わし、

X及びYのいずれか一方は-NH-又は



を表わし且つ他方は-O-, -S-, -NH-又は



を表わし、

nが1~4の整数である

化合物が挙げられる。

かくして、本発明により提供される前記一般式(I)で示される化合物の代表例を示せば次のとおりである。  
N-[4-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[4-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

28

4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,4-ジヒドロ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート

N-[4-(オレオイルチオ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[4-(オレオイルチオ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

S-[4-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンチオエート

S-[4-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンチオエート

N-[2-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

2-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

N-[2-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[2-(リノレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[2-(リノレノイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[2-(ステアロイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[2-(ラウロイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[2-(オクタノイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[3-(リノレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド N-[4-(ラウロイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

4-(リノレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

N-[2-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,4-シアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

50

(15)

29

N- [2-(オレオイルアミノ) フェニル] - 3- [N- (2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 N- [3-(オレオイルアミノ) フェニル] - 3- [N- (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 N- [3-(オレオイルアミノ) フェニル] - 3- [N- (2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 N- [4-(オレオイルアミノ) フェニル] - 3- [N- (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 N- [4-(オレオイルアミノ) フェニル] - 3- [N- (2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 4-(オレオイルアミノ) フェニル 3- [N- (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロピオネート  
 N- [4-(オレオイルオキシ) フェニル] - 3- [N- (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 S- [4-(オレオイルアミノ) フェニル] 3- [N- (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンチオエート  
 N- [4-(オレオイルチオ) フェニル] - 3- [N- (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 4-(オレオイルアミノ) フェニル 3- [N- (2,4-ジベンジルオキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロピオネート  
 N- (2-N-オレオイルアミノエチル) - 3- [N- (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 N- (3-N-オレオイルアミノプロビル) - 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド  
 N- (2-N-オレオイルアミノエチル) - 3- [N- (2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 2-(N-オレオイルアミノ) エチル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
 2-(N-オレオイルアミノ) エチル 3- [N- (2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロピオネート  
 3-(N-オレオイルアミノ) プロビル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
 3-(N-オレオイルアミノ) プロビル 3- [N- (2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ

30

ル) アミノ] プロピオネート  
 3- (N-オレオイルアミノ) プロビル 3- [N- (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロピオネート  
 4- (N-オレオイルアミノ) ブチル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
 4- (N-オレオイルアミノ) ブチル 3- [N- (2,4-ジヒドロシキ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロピオネート  
 S- [2-(N-オレオイルアミノ) エチル] 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンチオエート  
 S- [2-(N-オレオイルアミノ) エチル] 3- [N- (2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンチオエート  
 N- (3-オレオイルアミノプロビル) - 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド  
 N- (3-オレオイルアミノプロビル) - 3- [N- (2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 N- (4-オレオイルアミノブチル) - 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド  
 N- (4-オレオイルアミノブチル) - 3- [N- (2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 N- (4-オレオイルアミノブチル) - 3- [N- (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
 N- (6-オレオイルアミノヘキシル) - 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド  
 N- (5-オレオイルアミノペンチル) - 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド  
 N- (8-オレオイルアミノオクチル) - 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド  
 N- (2-オレオイルオキシエチル) - 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド  
 5-(N-オレオイルアミノ) ペンチル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
 6-(N-オレオイルアミノ) ヘキシル 3- [N-

(16)

31

(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2-(N-メチル-N-オレオイルアミノ) エチル 3-  
(N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-オレオイルアミノ) プロビル 3-[N-(2, 4-ジベンジルオキシ-3, 3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-オレオイルアミノ) プロビル 3-[N-(4-ベンジルオキシ-2-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-オレオイルアミノ) プロビル 3-[N-(2-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-4-(トリメチルアセチル) オキシ-1-オキソブチル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-オレオイルアミノ) プロビル 3-[N-(2-フェニル-5, 5-ジメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-オレオイルアミノ) プロビル 3-[N-(3, 3-ジメチル-1, 5-ジオキサスピロ[5, 5]ウンデカン-3-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-ヘキサデカノイルアミノ) プロビル  
3-(N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-リノレオイルアミノ) プロビル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-リノレンイルアミノ) プロビル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-オクタデカノイルアミノ) プロビル  
3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-テトラデカノイルアミノ) プロビル  
3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-ドデカノイルアミノ) プロビル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-デカノイルアミノ) プロビル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-オクタノイルアミノ) プロビル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-(N-ヘキサノイルアミノ) プロビル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
3-[N-(2-イソプロピルヘキサノイル) アミノ] プロビル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-

32

ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
3-[N-(2-t-ブチルヘキサノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
3-[N-(2-t-ブチルヘプタノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
3-[N-(2-t-ブチルノナノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
10 3-[N-(2,2-ジエチルウンデカノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
3-[N-(2-イソプロビルドデカノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
3-[N-(2-t-ブチルテトラデカノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
20 3-[N-(2-t-ブチルヘキサデカノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
3-[N-(2-イソプロビルヘプタデカノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
3-[N-(2-エチルオクタデカノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
30 3-[N-(2,2-ジメチル-10-ウンデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
3-[N-(2,2-ジメチル-7-ドデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
40 3-[N-(2,2-ジメチル-7-テトラデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
3-[N-(2,2-ジメチル-9-テトラデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
50 3-[N-(2,2-ジメチル-11-テトラデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロ

(17)

33

ピオネット

3-[N-(2,2-ジメチル-11-ペンタデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

3-[N-(2,2-ジメチル-9-ペンタデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

3-[N-(2,2-ジメチル-9-ヘキサデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

3-[N-(2,2-ジメチル-9-ヘプタデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

3-[N-(2,2-ジメチル-9-オクタデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

3-[N-(2-メチル-9-オクタデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

N- [2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N-{(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル}アミノ]プロパンアミド

N- [(1S, 2S) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル] - 3 - [N- { (2R) - 2, 4-ジアセトキシ-3, 3-ジメチル-1-オキソブチル} アミノ] プロパンアミド

N- [(1R, 2R) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル] - 3 - [N- { (2R) - 2, 4-ジヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-オキソブチル} アミノ] プロパンアミド

N- [(1S, 2S) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル] - 3 - [N- { (2R) - 2, 4-ジヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-オキソブチル} アミノ] プロパンアミド

N- [2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド  
N- [2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-

イル] - 3 - [N (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド  
N- [(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル] - 3 - [N- (2,2,5,5-テトラメ

34

## プロパンアミド

(1R, 2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル] 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

(1S, 2S) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン  
 - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3  
 - ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネー  
 ト

10 (1R, 2R) - 2 - (ステアロイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

(1S, 2S) - 2 - (リノレオイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

2-（1-オクチルシクロブタノイルアミノ）シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-（1-ノニルシクロブタノイルアミノ）シクロヘキサン-1-イル 3-[N-（2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル）アミノ]プロピオネート

2-(オレオイルアミノ)シクロヘプタン-1-イル  
 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
 2-(オレオイルアミノ)シクロヘプタン-1-イル

3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
 3 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル  
 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン

—4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
 4-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル  
 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-  
 -4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2 - (1-デシルシクロブチルカルボニルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

2- (1-ウンテシルシクロフチルカルボニルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3- [N- (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

2-(1-ペニタデシルシクロブチルカルボニルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート





(20)

39

4- (N-オレオイルアミノ) -2-ブチニル  
3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- [N- (1-ウンデシルシクロブチルカルボニル) アミノ] シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- [N- (1-ペンタデシルシクロブチルカルボニル) アミノ] シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- [N- [1- (9-オクタデセニル) シクロブチルカルボニル] アミノ] シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- [N- (1-デシルシクロペンチルカルボニル) アミノ] シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- [N- (1-トリデシルシクロヘプチルカルボニル) アミノ] シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- [N- (1-デシルシクロヘキシルカルボニル) アミノ] シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- [N- (1-ノニルシクロヘキシルカルボニル) アミノ] シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- [N- [1- (9-オクタデセニル) シルクヘキシリカルボニル] アミノ] シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- [N- (1-イソプロピルペンチルカルバモイル) アミノ] シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- (1-イソプロピルヘキシルカルバモイルアミノ) シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- (1-t-ブチルドデシルカルバモイルアミノ) シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- (1,1-ジメチルヘキサデシルカルバモイルアミノ) シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

40

アミノ] プロピオネート  
2- (オクタデシルカルバモイルアミノ) シクロペンタ  
ン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-  
1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオ  
ネート  
2- (1,1-ジメチルオクタデシルカルバモイルアミ  
ノ) シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5  
-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)  
アミノ] プロピオネート  
2- (1,1-ジメチル-9-デセニルカルバモイルアミ  
ノ) シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5  
-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)  
アミノ] プロピオネート  
2- (1,1-ジメチル-6-ウンデセニルカルバモイルア  
ミノ) シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,  
5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
ル) アミノ] プロピオネート  
2- (1,1-ジメチル-8-トリデセニルカルバモイル  
アミノ) シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,  
5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
ル) アミノ] プロピオネート  
2- (1-メチル-10-ペンタデセニルカルバモイルア  
ミノ) シクロペンタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,  
5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)  
アミノ] プロピオネート  
2- (1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニルカルバモイ  
ルアミノ) シクロペンタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,  
5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)  
アミノ] プロピオネート  
2- (1-メチル-8-ヘプタデセニルカルバモイルア  
ミノ) ペンタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テ  
トラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミ  
ノ] プロピオネート  
2- (8-オクタデセニルカルバモイルアミノ) シクロ  
ペンタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメ  
チル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プ  
ロピオネート  
2- (8,11-オクタデカジエニルカルバモイルアミノ)  
シクロペンタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テ  
トラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミ  
ノ] プロピオネート  
2- (1-メチル-8,11,14-オクタデカトリエニルカル  
バモイルアミノ) シクロペンタン-1-イル 3-  
[N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4  
-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
2- (1-ヘキシリシクロブチルカルバモイルアミノ)  
シクロヘプタン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テ  
トラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミ  
ノ] プロピオネート  
2- (1-オクチルシクロブチルカルバモイルアミノ)

(21)

41

シクロヘプタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-(1-オクチルシクロペンチルカルバモイルアミノ)シクロヘプタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-(1-オクチルシクロヘキシルカルバモイルアミノ)シクロヘプタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-(1-ヘプチルシクロペンテルカルバモイルアミノ)シクロペンタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-(1-デシルシクロペンチルカルバモイルアミノ)シクロペンタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-(1-ヘキシルシクロヘキシルカルバモイルアミノ)シクロヘプタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-(1-(6-ヘキサデセニル)シクロヘキシルカルバモイルアミノ)シクロペンタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-(1-(6-ヘキサデセニル)シクロブチルカルバモイルアミノ)シクロペンタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-(1-(6-ヘキサデセニル)シクロペンチルカルバモイルアミノ)シクロヘプタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-(デシルヘキシルカルバモイルアミノ)シクロペンタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-(ヘキシルオクチルカルバモイルアミノ)シクロヘプタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-[ブチル(1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル)カルバモイルアミノ]シクロペンタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
2-メチル-2-(N-リノレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

42

2-メチル-2-[N-(2-イソプロピルヘキサノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-メチル-2-[N-(2-t-ブチルヘプタノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

10 2-メチル-2-[N-(2,2-ジエチルウンデカノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-メチル-2-[N-(2,2-トリメチレンデカノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

20 2-エチル-2-(N-リノレノイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-イソプロピル-2-[N-(2-イソプロピルヘプタデカノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-イソブチル-2-[N-(2-エチルオクタデカノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2,2-ペンタメチレン-2-(N-リノレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

30 2-フェニル-2-(N-リノレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-ベンジル-2-(N-リノレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-ナフチル-2-[N-(2,2-ジメチル-9-テトラデセノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

40 2-(2-フリル)-2-[N-(2,2-ジメチル-9-オクタデセノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(2-フリル)-2-[N-(2,2-ジメチル-9-オクタデセノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-シクロペンチル-2-[N-(2,2-ジメチル-9-オクタデセノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

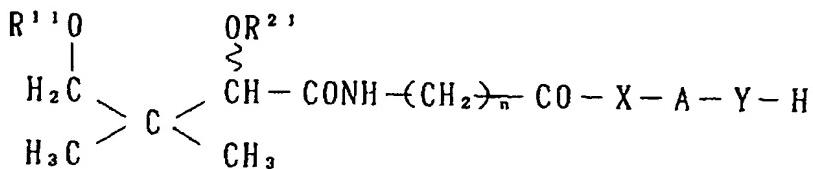
50 2-(3-インドリル)メチル-2-(N-リノレオイ

(22)

43

ルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
 2-(8-ヘプタデセニルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 2-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]アセテート  
 2-(1-メチル-8-ヘプタデセニルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 4-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]ブチレート

\*



(II)

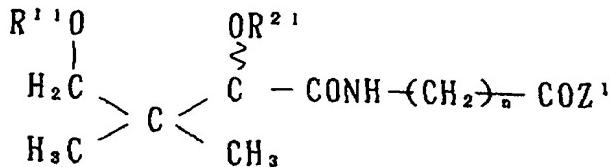
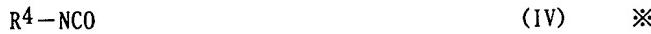
式中、

$\text{R}^{11}$ および $\text{R}^{21}$ は同一もしくは相異なり、各々水酸基の保護基を表す；

A, X, Yおよびnは前記定義のとおりである、で示される化合物を下記式



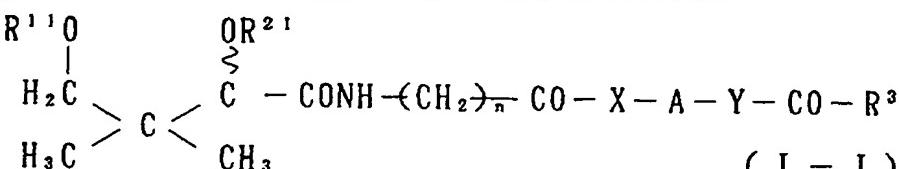
又は



(V)

式中、

$\text{R}^{11}, \text{R}^{21}, n$ および $Z^1$ は前記定義のとおりである、で示される化合物を下記式



(I-I)

式中、  
 $\text{R}^{11}, \text{R}^{21}, \text{R}^3, \text{A}, \text{X}, \text{Y}$ およびnは前記定義のとおりである、  
 で示される化合物から水酸基の保護基を脱離せしめることにより製造することができる。

方法(a)における式(II)の化合物と式(III)の化合物との反応ならびに方法(b)における式(V)の化合物と式(VI)の化合物との反応は通常適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トリエン、キシレン等の芳香族

50

44

\* 2-(1-メチル-8-ヘプタデセニルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 5-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]バレエート

本発明の化合物は、前記一般式(I)において\*印で示すように、不斉炭素原子を少なくとも1個含有しており、光学活性体(R-体またはS-体)またはラセミ体のいずれの形態のものをも含有するものである。

本発明の化合物は、例えば、

10 (a) 下記式

※ 式中、 $Z^1$ は水酸基; Cl, Br等のハロゲン原子; メトキ

20 シ、エトキシ等のアルコキシ基; フェノキシ、p-ニトロフェノキシ、2,4-ジニトロフェノキシ等の置換もしくは未置換のフェニルオキシ基を表わす；

$\text{R}^3$ および $\text{R}^4$ は前記定義のとおりである、で示される化合物を反応させるか、或いは

(b) 下記式

\*

★ 式中、

$\text{R}^3, \text{A}, \text{X}$ および $\text{Y}$ は前記定義のとおりである、  
 で示される化合物とを反応させ、そして必要に応じて

(c) 得られる下記式

炭化水素類; エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類; 酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類; 塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類; ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類; メタノール、エタノール等のアルコール類; 水などの単独または混合溶媒中で行うことができる。この反応は一般に-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内で行うことができる。また、

(23)

45

方法(a)および方法(b)においては、反応に触媒または反応促進剤を使用することもできる。使用しうる触媒または反応促進剤としては、例えば、ジシクロヘキシリカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-1カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ビリジン等の有機塩基類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物(II)または化合物(IV)に対して0.01~10当量、好ましくは0.1~1.1当量の範囲内で使用することができる。

また、化合物(III)又は(IV)の化合物(II)に対する使用割合は厳密に制限されるものではないが、化合物(III)又は(IV)は化合物(II)1モルに対して通常0.8~1.2モル、好ましくは1.0~1.1モルの範囲内で使用することができる。同様に、化合物(V)は化合物(VI)1モルに対して通常0.8~1.2モル、好ましくは1.0~1.1モルの範囲内で使用することができる。

方法(c)において化合物(I-I)から水酸基の保護基を脱離せしめる反応は、溶媒中、適当な触媒の存在下に加水分解することにより行うことができる。例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチレンエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハ

### 工程1：

(24)

46

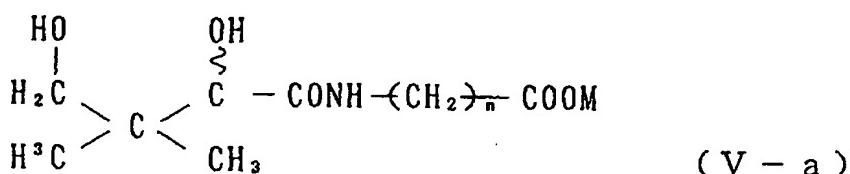
ロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；水；酢酸、プロピオン酸等の有機酸基；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類を単独または混合溶媒中で-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内で行うことができる。使用できる触媒としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ビリジン等の有機塩基類；塩酸、硝酸、硫酸等の鉱酸類；フッ化水素、臭化水素、ヨウ化水素等のハロゲン化水素類；トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸等の有機酸類があげられる。また、適当な金属触媒を用いて、常法に従い接触水素添加することにより保護基を脱離させることもできる。その際に使用しうる金属触媒としては、ニッケル、パラジウム、ロジウム、白金等の通常の水素添加触媒が用いられる。

上記の各方法で得られる生成物は、それ自体既知の方法、例えば結晶化、クロマトグラフィー、抽出、濾過等の方法を適宜組合せて使用することにより、反応混合物から分離し又は精製することができる。

上記の方法において出発原料として使用される式

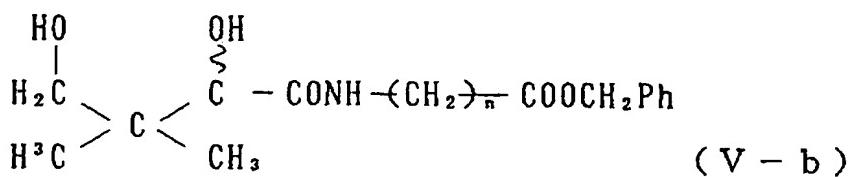
(V), (II)及び(VI)の化合物は、以下に述べるようにして製造することができる。

[式(V)の化合物の製造]

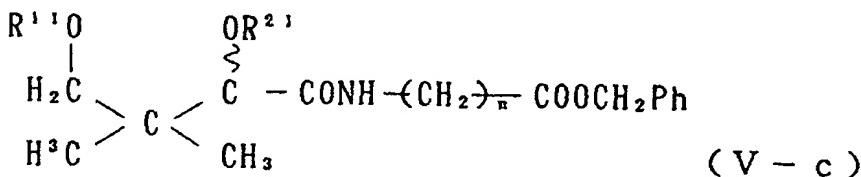


(24)

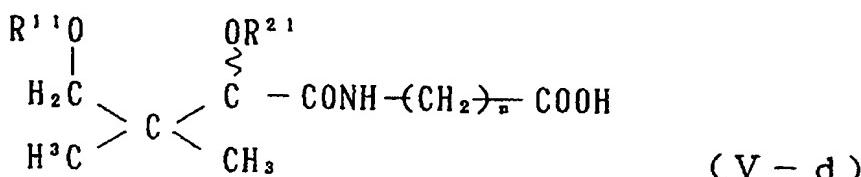
47  
工程2：



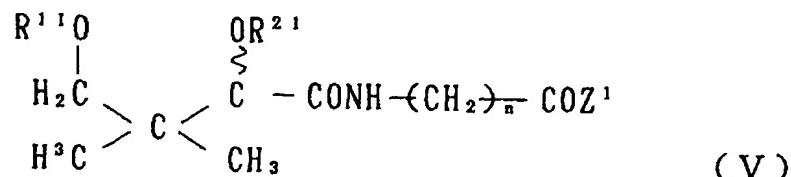
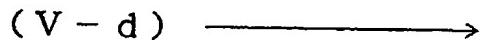
工程3：



工程4：



工程5：



工程6：

 $(V-a) \rightarrow (V-d)$ 

上記式中、Mは水素原子；ナトリウム、カリウム等のアルカリ金属原子またはマグネシウム、カルシウム等のアルカリ土類金属原子を表わし、LはOH, Cl, Br, IまたはN<sub>2</sub>を表わし、R<sup>11</sup>, R<sup>21</sup>, n及びZ<sup>1</sup>は前記定義のとおりである。

工程1：

この工程はパントイルラクトンと、ω-アミノカルボン酸とを反応させて化合物(V-a)を合成するもので

ある。パントイルラクトンは(D)-, (L)-及び(DL)-一体のいずれであってもよい。ω-アミノカルボン酸の例としては、アミノ酢酸(グリシン)、3-アミノプロピオン酸(β-アラニン)、4-アミノ酪酸(γ-アミノ酪酸、GABA)、5-アミノ吉草酸等があげられる。反応は溶媒を用いて行なうことが好ましく、例えば、ベンゼン、トリエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノ-

(25)

49

ル等のアルコール類；水を単独でまたは混合して使用することができる。この反応は一般に約0℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは、室温から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。この反応には触媒を用いることが好ましく、かかる触媒としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類があげられる。これら触媒はパントイ ルラクトンに対して0.01～10当量、好ましくは0.1～1.1当量の範囲内で使用することができる。

## 工程2：

この工程は、工程1で合成された化合物（V-a）をベンジル化して化合物（V-b）に変換するものである。ベンジル化の試薬としては、塩化ベンジル、臭化ベンジル、ヨウ化ベンジル等のハロゲン化ベンジル類；ベンジルアルコール；フェニルジアゾメタン等が用いられる。この反応は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒；メタノール、エタノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水などの単独または混合溶媒中で、-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。また、この反応には触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、例えばジシクロヘキシリカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；酢酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸等の有機酸類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物（V-b）に対して0.01～10当量、好ましくは0.1～1.1当量の範囲内で使用することができる。

## 工程3：

この工程は、前工程2において合成された化合物（V-b）の水酸基を保護して化合物（V-c）を合成する工程である。保護基（R<sup>11</sup>, R<sup>21</sup>）の導入のための反応試薬としては、例えば無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物；塩化アセチル、塩化ベンゾイル等の酸塩化物；酢酸、安息香酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸；オルト蟻酸エチル、オルト蟻酸メチル等のオルトエステル類；アセトン、シクロヘキサン等のケトン類；ベンズアルデヒド、アセトアルデヒド等のアルデヒド類；トリ

50

メチルシリルクロリド、ジメチルフェニルシリルクロリド等のシリル化剤；シアゾメタン、硫酸ジメチル等のアルキル化剤；ヨウ化メチル、塩化ベンジル等のハロゲン化アルキル類等が用いられる。この反応は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トリエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン類のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒；メタノール、エタノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水などの単独または混合溶媒中で、-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。また、この反応には触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、例えば、ジシクロヘキシリカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；酢酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸等の有機酸類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物（V-b）に対して0.01～10当量、好ましくは0.1～1.1当量の範囲内で使用することができる。

## 工程4：

この工程は、化合物（V-c）を加水分解または接触水素添加して化合物（V-d）に変換するものである。この反応は溶媒中で適当な触媒を用いて行うことができる。加水分解は、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；水；酢酸、プロピオン酸等の有機酸類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類の単独または混合溶媒中で-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。使用できる触媒としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；塩酸、硝酸、硫酸等の鉱酸類；フッ化水素、臭化水素、ヨウ化水素等のハロゲン化水素類；トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸等の有機酸類があげられる。一

(26)

51

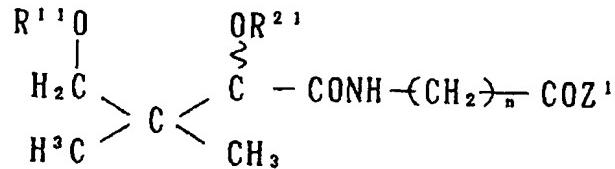
方、触媒水素添加はそれ自体既知の通常の方法で行なうことができ、金属触媒としては、ニッケル、パラジウム、ロジウム、白金等が用いられる。

工程5:

本工程は、化合物(V-d)を化合物(V)に変換する工程である。この反応において用いられる試薬としては、塩化チオニル、オキシ塩化リン、五塩化リン等のハロゲン化試薬類；または、メタノール、エタノール等のアルコール類；p-ニトロフェノール、2,4-ジニトロフェノール等のフェノール類などのエステル化試薬類が用いられる。本工程は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；水などの単独または混合溶媒中で、-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行なうことができる。また、反応に触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、ジシクロヘキシリカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物(V-d)に対して0.01~10当量、好ましくは0.1~1.1当量の範囲内で使用することができる。

工程6:

本工程は、化合物(V-a)から化合物(V-d)を合成する工程である。化合物(V-a)に反応させうる試薬としては、無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物；\*



52

\* 塩化アセチル、塩化ベンゾイル等の酸塩化物；酢酸、安息香酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸；オルト蟻酸エチル、オルト蟻酸メチル等のオルトエステル類；アセトン、シクロヘキサン等のケトン類；ベンズアルデヒド、アセトアルデヒド等のアルデヒド類；トリメチルシリルクロリド、ジメチルフェニルシリルクロリド等のシリル化剤；ジアゾメタン、硫酸ジメチル等のアルキル化剤；ヨウ化メチル、塩化ベンジル等のハロゲン化アルキル類等が用いられる。この反応は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水などの単独または混合溶媒中で、-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行なうことができる。また、この反応には触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、例えば、ジシクロヘキシリカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；酢酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸等の有機酸類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物(V-b)に対して0.01~10当量、好ましくは0.1~1.1当量の範囲内で使用することができる。

〔式(II)の化合物の製造〕

化合物(II)は、上記の如くして製造される下記式

(V)

式中、

$\text{R}^{11}, \text{R}^{21}, n$ および $\text{Z}^1$ は前記定義のとおりである、  
示される化合物を下記式

$\text{HX}-\text{A}-\text{YH}$  (VII)

式中、

$\text{A}, \text{X}$ および $\text{Y}$ は前記定義のとおりである、  
示される化合物とを反応させることにより得られる。  
本反応は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トルエ

ン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；水などの単独または混合溶媒中で、-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10℃から使用溶媒の沸

(27)

53

点温度の範囲内の温度で行うことができる。また、反応に触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、例えばジシクロヘキシカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイモド類；塩化チオニル、オキシ塩化リン、五塩化リン等のハロゲン化試薬類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；酢酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸等の有機酸類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物(V)に対して0.01~10当量、好ましくは0.1~1.1当量の範囲内で使用することができる。

## 〔式(VI)の化合物の製造〕

化合物(VI)は下記式



式中

A, XおよびYは前記定義のとおりである、

で示される化合物を下記式



式中、

 $R^3$ および $Z^1$ は前記定義のとおりである、

で示される化合物と反応させることにより得られる。

本反応は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；水などの単独または混合溶媒中で、-78°Cから使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10°Cから使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。また、反応に触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、例えばジシクロヘキシカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド等のカルボジイモド類；塩化チオニル、オキシ塩化リン、五塩化リン等のハロゲン化試薬類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；酢酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸等の有機酸類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物(V)に対して0.01~10当量、好ましくは0.1~1.1当量の範囲内で使用することができる。

(28)

54

ルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；塩化チオニル、オキシ塩化リン、五塩化リン等のハロゲン化試薬類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；酢酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸等の有機酸類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物(V)に対して0.01~10当量、好ましくは0.1~1.1当量の範囲内で使用することができる。

本発明により提供される前記式(I)の化合物は、優れたACAT阻害活性を有しており、高脂血症、動脈硬化症、狭心症、心筋梗塞、血栓症等の治療、処理、予防のための薬物として使用することが期待される。

本発明の化合物のACAT阻害活性は以下に述べる試験法により確認することができる。

ACAT阻害性試験は、Helgerudらの方法 [Journal of Lipid Research, 22, 497 (1981) 参照] 及びFolchらの方法 [Journal of Biological Chemistry, 226, 497 (1957) 参照] に準じ、[1-<sup>14</sup>C]オレオイルCoAと細胞内コレステロールとにより生成するコレステリルオレエートを測定することにより行なった。

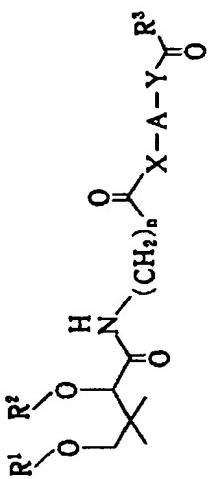
即ち、2 μM牛血清アルブミンと2 μM [1-<sup>14</sup>C]オレオイル-CoAとを0.514Mリン酸カリウム緩衝液(pH7.4)に溶かした溶液0.5mlに、ラット肝臓より調整したミクロソーム画分(0.3mg蛋白)を0.514Mリン酸カリウム緩衝液(pH7.4)に溶かした溶液10 μlと被験薬10<sup>-7</sup>Mをジメチルスルホキシドに溶かした溶液5 μlとを加え、37°Cで4分間反応させる。

その後、メタノール4.2ml及びクロロホルム8.3mlを加え反応を停止させ、水2.5mlを加え充分震盪後クロロホルム層を分取した。クロロホルム層を濃縮の後、薄層クロマトグラフィーに供し、生成したコレステリルオレエートを分取し、放射活性を液体シンチレーションカウンターにて測定する。

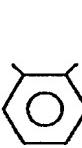
また、検体を用いることなく、上記と同一試験を行ない得られたコントロールの放射活性を基準として各被験化合物のACAT阻害活性を算出する。

その結果を下記第1表に示す。

表 第一



下記基團の 化合物	A						R <sup>a</sup>	ACAT 抑制率 (%) $[IC_50 \times 10^{-4} M]$
	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	Z		
1	X	2	NH	NH			$-(CH_2)_7-CH=CH_2$ $CH_3-(CH_2)_7-CH=CH_2$	83, 6 [2.95(1.87-4.47)]
2	Ac	Ac	2	NH	NH		$-(CH_2)_7-CH=CH_2$ $CH_3-(CH_2)_7-CH=CH_2$	84, 8 [2.74(1.87-4.02)]
4	X	2	NH	NH			$-(CH_2)_7-CH=CH_2$ $CH_3-(CH_2)_7-CH=CH_2$	79, 8
5	X	2	NH	NH			$-(CH_2)_7-CH=CH_2$ $CH_3-(CH_2)_7-CH=CH_2$	56, 0

下記表に 示す 化合物 番号	R'		R''		A		R'	ACAT 抑制率(%) $10^{-6} M$ [ $C_0 \times 10^{-3} M$ ]
	R' n	R' R'	n	X	Y			
15		×	2	0	NH		$-(CH_2)_2 - CH$ $CH_3 - (CH_2)_2 - CH$	57
9		×	2	NH	NH		$-(CH_2)_2 - CH = CH$ $CH_3 - (CH_2)_4 - CH = CH$	51.8
33	×	×	2	NH	NH	$-(CH_2)_2 -$	$-(CH_2)_2 - CH$ $CH_3 - (CH_2)_2 - CH$	73.1 [2.99(1.55-5.69)]
34	×	×	2	NH	NH	$-(CH_2)_2 -$	$-(CH_2)_2 - CH$ $CH_3 - (CH_2)_2 - CH$	85.1 [3.85(2.07-7.16)]
37	×	×	2	NH	NH	$-(CH_2)_2 -$	$-(CH_2)_2 - CH$ $CH_3 - (CH_2)_2 - CH$	72.6 [2.86(1.44-5.68)]
40	×	×	2	NH	NH	$-(CH_2)_2 -$	$-(CH_2)_2 - CH$ $CH_3 - (CH_2)_2 - CH$	75.6
41	×	×	2	NH	NH	$-(CH_2)_2 -$	$-(CH_2)_2 - CH$ $CH_3 - (CH_2)_2 - CH$	68.2

(29)

58

下記実験の 例番号 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>a</sup>	ACAT 抑制率 [% $\times 10^{-3}$ ]	[ $[C_{40} \times 10^{-3}]$ ]
42	X	X	2	NH	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>1</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	82.0	
44	X	X	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	[6.86(4.37-10.8)]	59
45	H	H	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	51.1	
46	X	X	2	0	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	65.6	
47	X	X	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	[2.50(1.45-4.37)]	81.3
48	H	H	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	58.7	
51	PhCO	H	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	84.9	
52	Ph		2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	85.5	
53			2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	84.6	

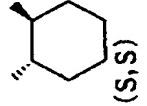
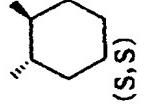
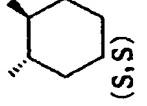
(31)

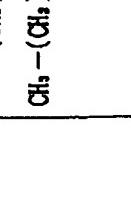
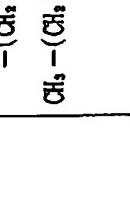
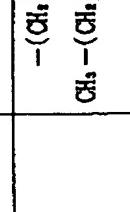
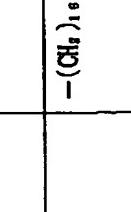
61

62

下記番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>a</sup>	ACAT $\frac{10^{-3}M}{[IC_0 \times 10^{-3}M]}$	抑制率(%)
54	tBuOCO	H	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> , -CH CH <sub>2</sub> - (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> , -CH	83.2	
58	X	X	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> , -CH <sub>3</sub>	53.2	
59	X	X	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> , -CH <sub>3</sub>	54.3	
60	X	X	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> , -CH <sub>3</sub>	64.5	
61	X	X	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> , -CH <sub>3</sub>	61.6	
62	X	X	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> \ CH=CH CH=CH\ CH <sub>2</sub>	79.0	
63	X	X	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> , -(CH=CHCH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> , -CH <sub>3</sub>	77.5	
64	X	X	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> , -CH CH <sub>2</sub> - (CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> , -CH	81.1 [1.35(1.9)-4.17]	
65	H	H	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> , -CH CH <sub>2</sub> - (CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> , -CH	80.7	

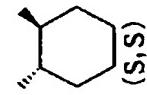
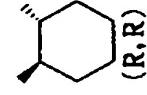
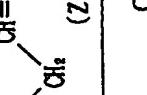
(32)

下記表の 例番の 化合物	ACAT 抑制率(%) $10^{-4} \times [C_{50} \times 10^{-7} M]$				R <sup>a</sup>		
	R <sup>b</sup>	R <sup>c</sup>	n	X	Y	A	
66	$\times$	2	0	NH	$-(CH_2)_5-$	$-(CH_2)_7-CH$ $CH_3-(CH_2)-CH$	$83.6$ [3.55(1.82-7.08)]
67	$\times$	2	0	NH	$-(CH_2)_6-$	$-(CH_2)_7-CH$ $CH_3-(CH_2)-CH$	$84.4$ [3.89(2.29-6.61)]
68	$\times$	2	S	NH	$-(CH_2)_5-$	$-(CH_2)_7-CH$ $CH_3-(CH_2)-CH$	$83.8$
69	H	2	S	NH	$-(CH_2)_5-$	$-(CH_2)_7-CH$ $CH_3-(CH_2)-CH$	$81.8$
70	$\times$	2	NH	NH		$-(CH_2)_7-CH$ $CH_3-(CH_2)-CH$	$85.8$ [1.62(0.80-3.29)]
71	Ac	Ac	2	NH	NH		$81.7$ [1.98(1.95-4.47)]
74	H	H	2	NH	NH		$87.3$ [1.55(1.12-2.14)]

下記実施 例番号の 化合物	R'	R"	n	X	Y	A	R"	ACAT	抑制率(%)
								$10^{-4} \text{M}$	$[C_{50} \times 10^{-7} \text{M}]$
76	Ac	(S)	2	NH	NH		$-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}=\text{CH}-$ $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	86.0 [3.60(1.88-0.92)]	65
77	X		2	O	NH		$-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}=\text{CH}-$ $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	86.9 [2.1(1.88-2.34)]	
78	X		2	O	NH		$-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}=\text{CH}-$ $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	86.9 [0.40(0.29-0.553)]	
79	X		2	O	NH		$-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	51.3	
80	X		2	O	NH		$-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}=\text{CH}-$ $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_4-\text{CH}=\text{CH}_2$	83.5 [1.08]	66

(33)

(34)

下記実施 例番号 の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) $10^{-6} M$ [ $[C_0] \times 10^{-1} M$ ]	67
81	X		2	0	NH	-CH-CH <sub>2</sub> - CH <sub>3</sub> (R)	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	77.1	
82	X		2	0	NH	-CH-CH <sub>2</sub> - CH <sub>3</sub> (S)	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	82.4	
83	X		2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	85.4	
84	X		2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	88.2	
85	X		2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	77.9	
86	X		2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	51.5	

(35)

69

70

下記表 の 例番 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>1</sup>	ACAT 抑制率(%) $\times 10^{-4}$ [ $C_6H_6 \times 10^{-7}M$ ]
87	×	2 0	NH			$\begin{array}{c} CH_3 \\    \\ -CH_2-CH- \\   \\ S \end{array}$	$-(CH_2)_7CH=CH(CH_2)_7CH_3$	81.3
88	×	2 0	NH			$\begin{array}{c} CH_3 \\   \\ CH=CH \\   \\ -CH_2- \\   \\ E \end{array}$	$-(CH_2)_7CH=CH(CH_2)_7CH_3$	81.7
89	×	2 0	NH			$-CH_2-C\equiv C-CH_2-$	$-(CH_2)_7CH=CH(CH_2)_7CH_3$	88.9
90	×	2 0	NH				$-(CH_2)_7CH=CH(CH_2)_7CH_3$	89.4
91	×	2 0	NH				$-(CH_2)_7CH=CH(CH_2)_7CH_3$	90.6
92	×	2 0	NH				$-(CH_2)_7CH=CH(CH_2)_7CH_3$	86.4

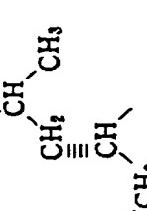
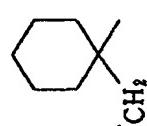
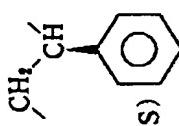
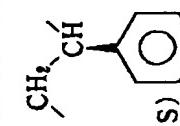
(36)

下記実験 例番号の 化合物	R'	R"	n	X	Y	A	R"	ACAT 抑制率(%) $10^{-4} \times [IC_{50} \times 10^{-3} M]$	
								(36)	71
93	×	×	2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	95.3	
94	×	×	2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	94.3	
95	×	×	2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	90.0	
96	×	×	2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	88.4	
97	×	×	2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	84.2	

(37)

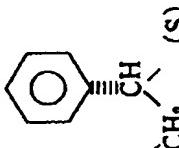
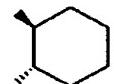
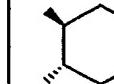
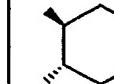
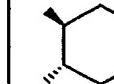
73

74

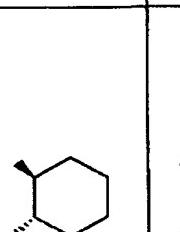
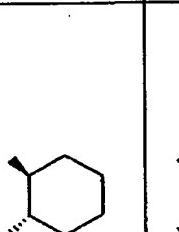
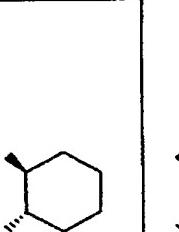
下記実施例番号の 化合物	R'	R''	n	X	Y	A	R'	ACAT(%) $10^{-4}M$	抑制率(%) $[C_0 \times 10^{-7}M]$
98	X		2	0	NH		-(CH3), CH=CH(CH3), CH3	89.1	
99	X		2	0	NH		-(CH3), CH=CH(CH3), CH3	85.8	
100	X		1	0	NH		-(CH3), CH=CH(CH3), CH3	90.0	
101	X		3	0	NH		-(CH3), CH=CH(CH3), CH3	84.6	

(38)

75

下記表の 例番値 化合物	R'	R"	n	X	Y	A	R*	ACAT 抑制率(%) $10^{-4} \mu M$ [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-4</sup> M]	75
								(38)	
102	×	4 0	NH				-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH=CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , CH <sub>3</sub>	84.3	
103	×	2 0	NH				Cl <sub>3</sub> -C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> CH <sub>3</sub> Cl <sub>3</sub>	63.9	
104	×	2 0	NH				Cl <sub>3</sub> -C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH=CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , CH <sub>3</sub> Cl <sub>3</sub>	94.2	
105	×	2 0	NH				Cl <sub>3</sub> -Cl(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH=CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , CH <sub>3</sub>	95.6	
106	×	2 0	NH				Cl <sub>3</sub> -CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> -CH <sub>3</sub>	91.5	

(39)

下記表の 例番号 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R'	ACAT 抑制率(%) $[IC_50 \times 10^{-7} M]$
107	×	2 0	NH				CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> -CH <sub>3</sub>	92.9
108	×	2 0	NH				CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>11</sub> -CH <sub>3</sub>	93.6
109	×	2 0	NH				CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>11</sub> -CH <sub>3</sub>	93.3
110	×	2 0	NH				(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>11</sub> -CH <sub>3</sub>	68.3
111	×	2 0	NH				(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>11</sub> -CH <sub>3</sub>	58.3
112	×	2 0	NH				CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>3</sub>	95.4

(40)

79

80

下記実施例番号の化合物	R'	R"	n	X	Y	A	R'	ACAT 抑制率(%) [ $C_0 \times 10^{-4} M$ ]
			2	0	NH			
113	×							86.1
114	×		2	0	NH			84.2
115	×		2	0	NH		$-\text{NH}-\text{CH}-(\text{CH}_2)_6\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)\text{CH}_3$	95.1
116	×		2	0	NH		$-\text{NH}-\text{CH}-(\text{CH}_2)_6-\text{CH}_3$	92.7
117	×		2	0	NH			79.0

(41)

81

82

下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) $10^{-4} \times [IC_{50} \times 10^{-7} M]$
118	×	2 0	NH				$\begin{array}{c} \text{CH}(\text{CH}_3)_2 \\   \\ -\text{CH}-(\text{CH}_2)_9-\text{CH}_3 \end{array}$	88.2
119	×	2 0	NH				$\begin{array}{c} \text{CH}(\text{CH}_3)_2 \\   \\ -\text{CH}-(\text{CH}_2)_9-\text{CH}_3 \end{array}$	76.0
120	×	2 0	NH				$\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\   \\ \text{CH}_2-\text{C} \\   \\ \text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$	41.0
123	×	2 0	NH				$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH}-(\text{CH}_2)_9-\text{CH}_3 \end{array}$	94.1
124	×	2 0	NH				$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH}-(\text{CH}_2)_9-\text{CH}_3 \end{array}$	87.7
128	×	2 0	NH				$\begin{array}{c} \text{CH}(\text{CH}_3)_2 \\   \\ -\text{N}-(\text{CH}_2)_9-\text{CH}_3 \end{array}$	88.2

(42)

下記表の 番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) $\times 10^{-1}$ [ $[C_0 \times 10^{-4} M]$ ]
127	×	2 0	NH				$CH_3 - C(CH_3)_2$ $-CH_2 - (CH_2)_3 - CH_3$	95.8
128	×	2 0	NH				$CH_3 - C_6H_5$ $-CH_2 - (CH_2)_3 - CH_3$	81.8
129	×	2 0	NH				$CH_3 - C_6H_5$ $-CH_2 - (CH_2)_3 - CH_3$	87.5
130	×	2 0	NH				$C_6H_5$ $-CH_2 - (CH_2)_3 - CH_3$	91.9
131	×	2 0	NH				$C_6H_5$ $-CH_2 - (CH_2)_3 - CH_3$	87.6
134	×	2 0	NH				$CH_3 - C_6H_5$ $-CH_2 - (CH_2)_3 - CH_3$	95.1

83

84

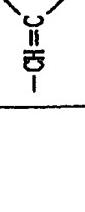
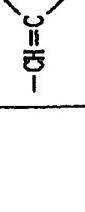
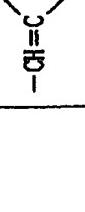
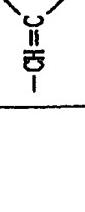
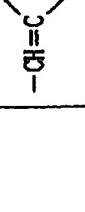
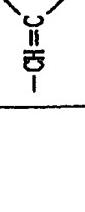
(43)

下記実施例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>a</sup>	ACT 抑制率(%) [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-7</sup> M]
								(43)
135	X		2 0	NH			85 93.9	
136	X		2 0	NH			59.7 63.5	
137	X		2 0	NH			63.5	
138	X		2 0	NH			88.3	
139	H	H	2 0	NH			63.9 86	

(44)

下記番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R*	ACAT 抑制率(%) $10^{-6} \mu$ [ $C_0 \times 10^{-4} M$ ]	87
140	×	2 0	NH				CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -N-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -CH <sub>3</sub>	84.4	
141	×	2 0	NH				CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -N-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -CH <sub>3</sub>	89.9	
142	×	2 0	NH				CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -N-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -CH <sub>3</sub>	87.9	
143	×	2 0	NH				CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -Cl-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -CH <sub>3</sub>	82.2	
144	×	2 0	NH				CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -Cl-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -CH <sub>3</sub>	80.0	
145	×	2 0	NH				-Cl=C(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	89.0	

(45)

下記書式 の 化合物 例番	ACAT 抑制率(%)				[ $C_{50} \times 10^{-7}$ M]			
	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>a</sup>	
146	×	2	0	NH			$-\text{CH}=\text{C}\begin{cases} \text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5 \\ \text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5 \end{cases}$	88.1
147	×	2	0	NH			$-\text{CH}=\text{C}\begin{cases} (\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \\ (\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \end{cases}$	97.3
150	×	2	0	NH			$-\text{CH}_2-\text{CH}\begin{cases} (\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \\ (\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \end{cases}$	97.7
151	×	2	0	NH			$-\text{C}=\text{C}\begin{cases} \text{CH}_2-\text{CH}_3 \\ \text{C}_6\text{H}_5 \end{cases}$	97.3
152	×	2	0	NH			$-\text{C}=\text{C}\begin{cases} \text{C}_6\text{H}_5 \\ (\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \end{cases}$	97.5
153	×	2	0	NH			$-\text{C}=\text{C}\begin{cases} \text{C}_6\text{H}_5 \\ (\text{CH}_2)_3\text{CH}_3 \end{cases}$	97.5

(46)

下記番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT $10^{-4} \mu$ 抑制率(%)	$[IC_50 \times 10^{-4} M]$
154	×	2 0	NH				$-(CH_2)_6CH_3$ $-C=C-$ H $C_6H_5$	91.6	
155	×	2 0	NH				$(CH_2)_6CH_3$ $-C=CH-$ $(CH_2)_6CH_3$	92.5	
156	×	2 0	NH				$(CH_2)_6CH_3$ $-C=CH-$ $(CH_2)_6CH_3$	96.3	
157	×	2 0	NH				$CH_3-C_6H_5$ $-N-$ $(CH_2)_6CH_3$	97.3	
158	×	1 0	NH				$CH_3-C_6H_5$ -CH $(CH_2)_6CH_3$	97.8	
159	×	2 0	NH				$(CH_2)_6CH_3$ -CH $(CH_2)_6CH_3$	98.2	

(47)

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	A	ACAT 抑制率 (%) $[IC_{50} \times 10^{-4} M]$
160	X	X	(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH <sub>3</sub>	93
161	X	X	-NH-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	98.9
162	X	X	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	64.3
163	X	X	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	97.1
164	X	X	(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	94.6

上記表中、  
  
 =CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、Ac=CH<sub>2</sub>CO、Ph=フェニル

本発明の化合物を薬物として高脂血症、動脈硬化症、狭心症、心筋梗塞、血栓症等の病気の治療、処置、予防等に使用する場合、該化合物は製薬助剤、例えば製薬学的に許容しうる担体、希釈剤、賦形剤、結合剤、崩解剤、潤滑剤、防腐剤、安定化剤、溶解助剤、香味剤等と共に、投与に適した剤形、例えば錠剤、カプセル剤、散剤、顆粒剤、マイクロカプセル剤、シロップ剤、エリキシリ剤、注射剤、坐剤等の単位投与形態に製剤化することができる。

これら製剤における有効成分の含有量は、本発明の化合物の種類、製剤のタイプ、使用目的等に応じて広い範

囲で変えることができるが、一般には0.5~90重量%、好ましくは5~60重量%の範囲内とすることができます。錠剤、カプセル剤、散剤、顆粒剤等の固体の調製物においては、本発明の化合物を、乳糖、マンニトール、ブドウ糖、ヒドロキシプロピルセルロース、微結晶セルロース、カルボキメチルセルロース、デンプン、ポリビニルピロリドン、メタケイ酸アルミニウム、タルク糖の担体又は希釈剤；ステアリン酸マグネシウム等の潤滑剤；繊維素グルコン酸カルシウム等の崩解剤；グルタミン酸、アスパラギン酸等の溶解助剤；ラクトース等の安定化剤と共に常法に従って製剤化することができる。ま

(48)

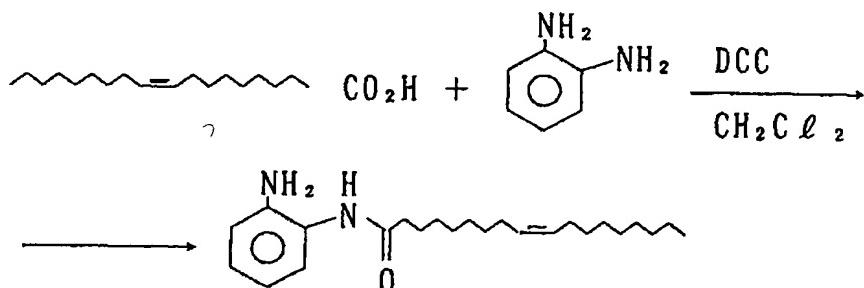
95

た、錠剤には必要により、白糖、ゼラチン、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース等の胃溶性又は腸溶性物質でコーティングを施してもよく、カプセル剤はハードカプセル剤としてもよく、またソフトカプセル剤にしてもよい。

シロップ剤、エリキシル剤、溶液剤、乳濁剤、懸濁剤等の液状の調製物の場合には、本発明の化合物を製薬学的に許容しうる液体媒体、例えば精製水、生理食塩水、緩衝液、エタノール等に溶解ないし分散させ、さらに必要に応じて、界面活性剤、甘味剤、風味剤、芳香剤、防腐剤等を適宜配合することにより製剤化することができる。

他方、非経口投与のための注射剤としては、無菌の水性又は非水性の溶液、懸濁液及び乳濁液が含まれる。そのような注射剤は、本発明の化合物を注射用蒸留水、生理食塩水等の水性希釈剤又はポリエチレングリコール、プロピレングリコール、オリーブ油、エタノール、ポリソルベート80（登録商標）等の非水性希釈剤と混合することにより調製することができる。さらに、注射剤には必要に応じて、防腐剤、潤滑剤、界面活性剤、分散剤、\*<sup>20</sup>

### ○-オレオイルアミノアニリン



オレイン酸2.82gと○-フェニレンジアミン1.62gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド2.27gを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.84g（収率76%）を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν NH 3284, ν C=O 1646

質量分析 分子式; C<sub>24</sub>H<sub>40</sub>N<sub>2</sub>O

(49)

96

\* 安定化剤、溶解助剤等の助剤を含ませることもできる。これらの注射剤は通常、バクテリア保留フィルター等を用いて濾過、殺菌剤の配合又は照射等により無菌化することができ、さらにこれらの処理をしたのち、凍結乾燥等の方法により固体調製物とした使用直前に無菌水又は無菌の注射用希釈剤を加えて使用することもできる。

本発明の化合物は、経口投与又は直腸投与により或いは静脈内、筋肉内、皮下等の非経口投与によって投与することができる。その投与量は、用いる化合物の種類、

10 投与の方法、処理すべき患者の症状の軽重、患者の年令や体重、医師の判断等に応じて変えることができるが、一般には、1日当り約2～約500mg/kg体重を1日1回又は2～4回に分割投与するのが適当である。しかし、上記投与量範囲はあくまでも一応の目安であり、医師の判断、症状の軽重等に応じて、上記範囲以上又は以下の量を投与することも勿論可能である。

以下、実施例により本発明をさらに具体的に説明する。

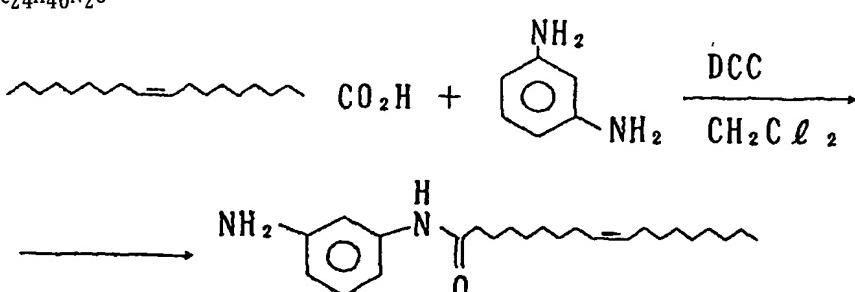
### 参考例-1

理論値 372.3140

実測値 372.3129

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
1.18-1.45 (20H, m) , 1.65-1.81 (2H, m) ,  
1.90-2.09 (4H, m) , 2.41 (2H, t, J=7Hz) ,  
3.84 (2H, brs) , 5.28-5.43 (2H, m) ,  
6.76-6.83 (2H, m) , 7.02-7.13 (2H, m) ,  
7.17 (1H, d, J=8Hz)

40 2-ミノ-○-オレオイルアミノアニリン



(49)

97

オレイン酸2.82gとm-フェニレンジアミン1.62gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシリカルボジイミド2.27gを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.60g（収率70%）を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{NH}}$ 3324,  $\nu_{\text{C=O}}$ 1658質量分析 分子式;  $\text{C}_{24}\text{H}_{40}\text{N}_2\text{O}$ 

(49)

98

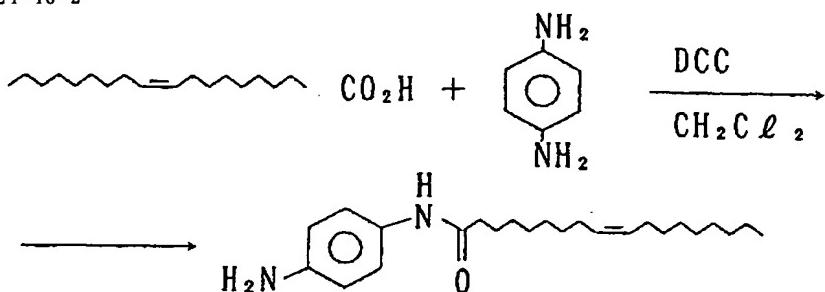
\* 理論値 372.3140

実測値 372.3143

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
1.20-1.42 (20H, m) , 1.64-1.78 (2H, m) ,  
1.90-2.09 (4H, m) , 2.32 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
3.70 (2H, brs) , 5.29-5.40 (2H, m) ,  
6.42 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 6.62 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) ,  
7.00 (1H, brs) , 7.21 (1H, s)

3 p-オレオイルアミノアニリン

\* 10



オレイン酸2.82gとp-フェニレンジアミン1.62gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシリカルボジイミド2.27gを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.85g（収率77%）を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{NH}}$ 3294,  $\nu_{\text{C=O}}$ 1656質量分析 分子式;  $\text{C}_{24}\text{H}_{40}\text{N}_2\text{O}$ 

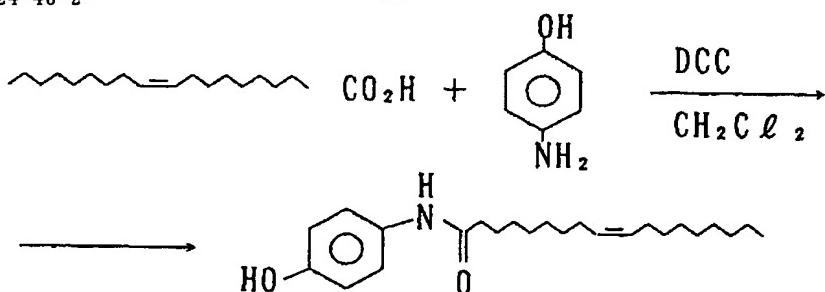
20※ 理論値 372.3140

実測値 372.3138

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
1.18-1.42 (20H, m) , 1.64-1.77 (2H, m) ,  
1.92-2.09 (4H, m) , 2.31 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
3.60 (2H, brs) , 5.29-5.40 (2H, m) ,  
6.65 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ ) , 6.92 (1H, brs) ,  
7.26 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ )

4 p-オレオイルアミノフェノール

※



オレイン酸2.82gとp-アミノフェノール1.64gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシリカルボジイミド2.27gを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.57g（収率42%）を得た。

性状；油状

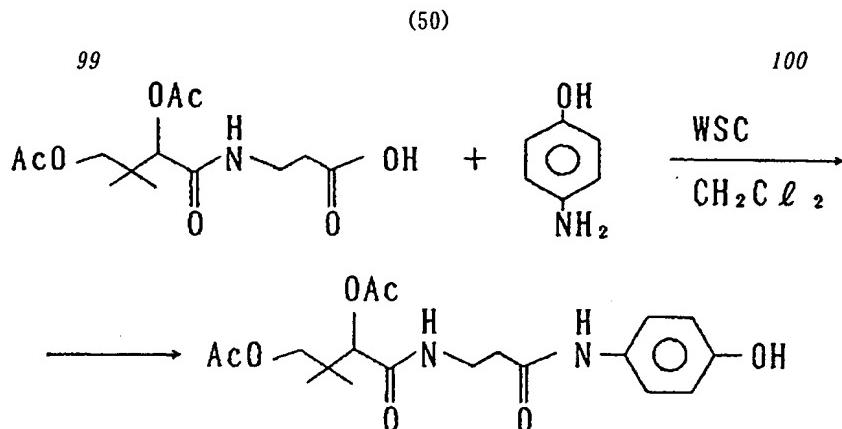
IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{NH}}$ ,  $\nu_{\text{C=O}}$ 1646質量分析 分子式;  $\text{C}_{24}\text{H}_{39}\text{NO}_2$ 

40 理論値 373.2980

実測値 373.2988

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
1.20-1.42 (20H, m) , 1.65-1.79 (2H, m) ,  
1.89-2.09 (4H, m) , 2.31 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
5.28-5.41 (2H, m) , 6.77 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ ) ,  
7.04 (1H, brs) , 7.32 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ )

5 2,4-ジアセトキシ-N-[3-[(4-ヒドロキシフェニル)アミノ]-3-オキソプロピル]-3,3-ジシメチルブタンアミド



3 - [N - (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロピオン酸 3.03g と p-アミノフェノール 2.18g を塩化メチレン 50ml に溶かし、  
氷冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド 2.30g を添加し、室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物 1.92g (収率 50%) を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu$  1750, 1660

質量分析 分子式;  $C_{19}H_{26}N_2O_7$

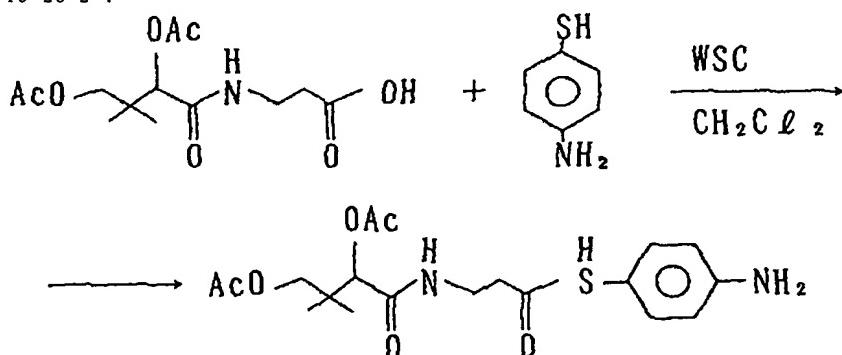
\* 理論値 394.1740

実測値 394.1746

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 1.02 (3H, s) , 1.06 (3H, s) , 2.05 (3H, s) , 2.07 (3H, s) , 2.55 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 3.55-3.71 (2H, m) , 3.84 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.03 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.90 (1H, s) , 6.74-6.83 (1H, m) , 6.79 (2H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.35 (2H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.47 (1H, brs)

20 6 S - (4-アミノフェニル) 3 - [N - (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンチオネート

\*



3 - [N - (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロピオン酸 1.52g と p-アミノチオフェノール 1.00g を塩化メチレン 50ml に溶かし、氷冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド 2.30g を添加し、室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物 0.335g (収率 16%) を得た。

性状；油状

質量分析 分子式;  $C_{19}H_{26}N_2O_6S$

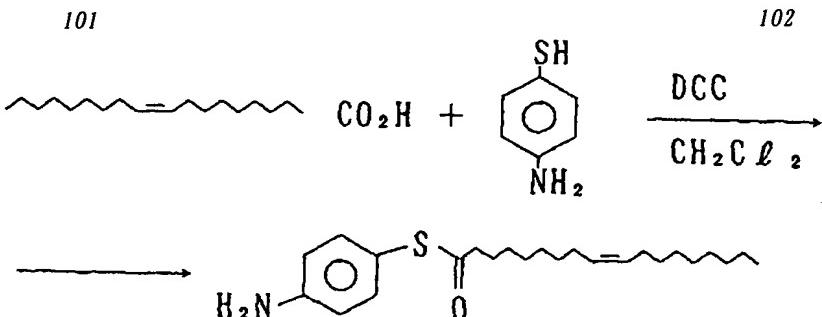
理論値 410.1511

実測値 410.1520

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 1.01 (3H, s) , 1.06 (3H, s) , 2.06 (3H, s) , 2.11 (3H, s) , 2.87 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 3.44-3.69 (2H, m) , 3.81 (1H, d,  $J=11\text{Hz}$ ) , 4.03 (1H, d,  $J=11\text{Hz}$ ) , 4.97 (1H, s) , 6.50 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 6.92 (2H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.24 (2H, d,  $J=8\text{Hz}$ )

7 S - (4-アミノフェニル) 9-オクタデセンチオエート

(51)



オレイン酸2.82gとp-アミノチオフェノール1.88gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシリカルボジイミド2.27gを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.86g（収率74%）を得た。

性状；油状

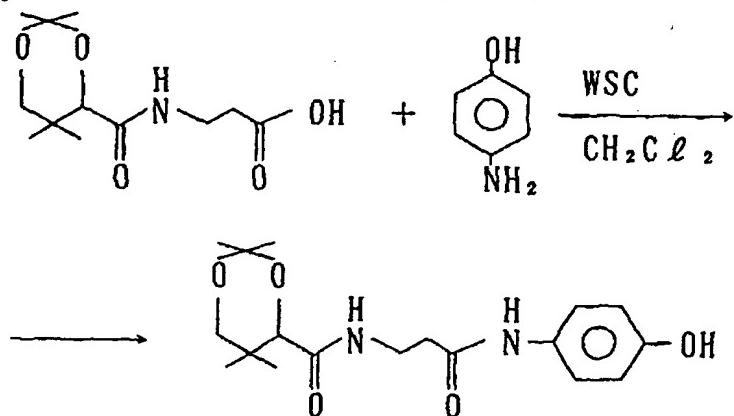
IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{NH}}$ 3500,  $\nu_{\text{C=O}}$ 1698

質量分析 分子式; C<sub>24</sub>H<sub>39</sub>NOS

10 \* 理論値 389.2752

実測値 389.2754

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 1.19-1.41 (20H, m) , 1.62-1.75 (2H, m) , 1.91-2.09 (4H, m) , 2.60 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 3.83 (2H, brs) , 5.29-5.41 (2H, m) , 6.68 (2H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.16 (2H, d,  $J=8\text{Hz}$ )  
8 N- (4-ヒドロキシフェニル) -3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド



3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸1.04gとp-アミノフェノール0.665gとを塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロビル) カルボジイミド0.96gを添加し、室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.37g（収率98%）を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C=O}}$ 1660

質量分析 分子式; C<sub>18</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>

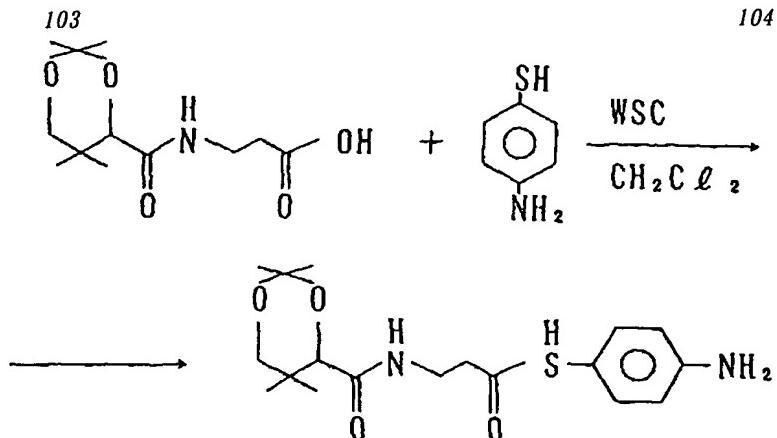
理論値 350.1841

実測値 350.1846

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.41 (3H, s) , 1.45 (3H, s) , 2.26 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 3.50-3.72 (2H, m) , 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.10 (1H, s) , 6.78 (2H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.13 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 7.32 (2H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 8.02 (1H, s)

40 9 S- (4-アミノフェニル) 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンチオアート

(52)



3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸1.30gとp-アミノチオフェノール1.00gとを塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド0.96gを添加し、室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.28g(収率15%)を得た。

性状：油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{CO}} 1692$

\* 質量分析 分子式： $C_{18}H_{26}N_2O_4S$

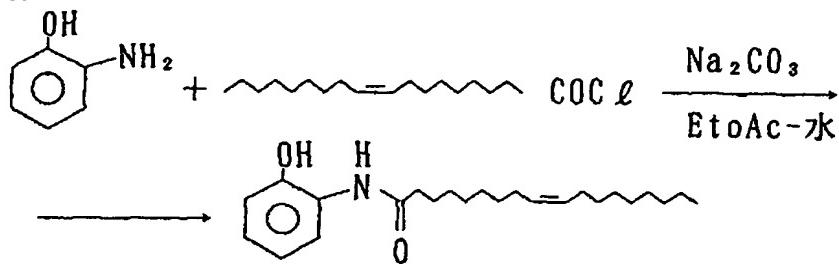
理論值 366.1613

実測値 366.1608

<sup>20</sup> NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 1.00 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.42 (3H, s) , 1.45 (3H, s) , 2.78-2.97 (2H, m) , 3.29 (1H, d, J=11Hz) , 3.45-3.71 (2H, m) , 3.69 (1H, d, J=11Hz) , 4.08 (1H, s) , 6.69 (2H, d, J=8Hz) , 6.84-6.92 (1H, m) 7.15 (2H, d, J=8Hz)

#### 10 o-オレオイルアミノフェノール

\*



2-アミノフェノール1.09gを酢酸エチル20mlと水20mlとの混合溶媒に溶かし炭酸ナトリウム1.27gを添加し氷冷攪拌下に、オレイン酸クロリド3.01gを酢酸エチル10mlに溶かした溶液を滴下し、そのまま2時間攪拌した。反応終了後、有機層を分取し、有機層を水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.40g(収率91%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{CO}} 1646$

質量分析 分子式： $C_{24}H_{39}NO_2$

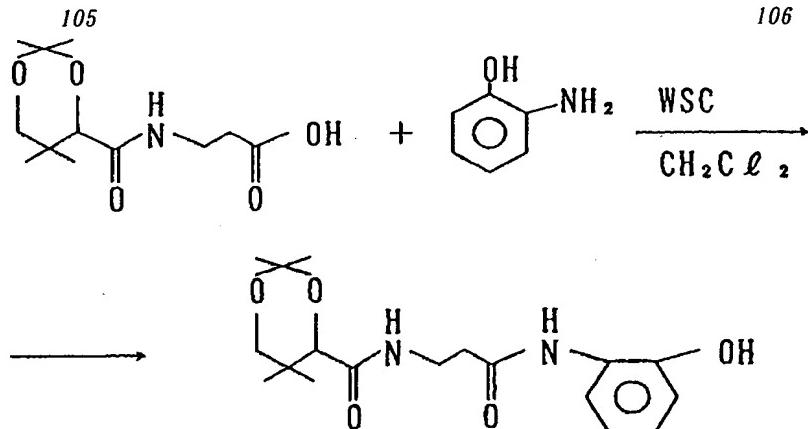
理論值 373.2980

実測値 373.2988

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) : 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
 1.18-1.45 (20H, m) , 1.66-1.80 (2H, m) ,  
 1.92-2.10 (4H, m) , 2.45 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
 5.28-5.40 (2H, m) , 6.85 (2H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) ,  
 6.97 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.02 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) ,  
 7.13 (2H, t,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.45 (1H, brs)

40 11 N- (2-ヒドロキシフェニル) - 3 - [N- (2,2,  
5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
ル) アミノ] プロパンアミド

(53)



3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオニ酸 0.26g と o-アミノフェノール 0.13g を塩化メチレン 10ml に溶かし、冰冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロビル) カルボジイミド 0.20g を添加し、室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物 0.34g (収率 98%) を得た。

性状：油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{CO}} 1660$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{18}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_5$ 

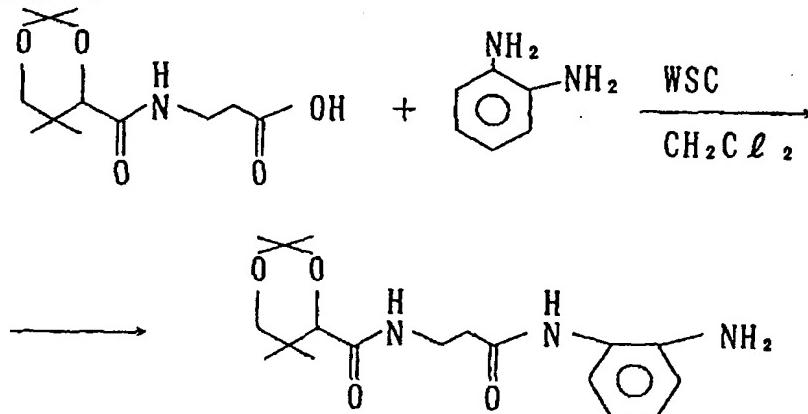
\* 理論値 350.1841

実測値 350.1843

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.97 (3H, s) , 1.03 (3H, s) , 1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 2.77 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 3.28 (2H,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.59-3.77 (2H, m) , 4.11 (1H, s) , 6.86 (1H, t,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.01 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.08-7.22 (3H, m) , 8.80 (1H, s)

12 N - (2-アミノフェニル) - 3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド

\*



3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオニ酸 3.89g と o-フェニレンジアミン 2.16g を塩化メチレン 50ml に溶かし、冰冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロビル) カルボジイミド 2.88g を添加し、室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物 2.48g (収率 47%) を得た。

性状：油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{CO}} 1660$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{18}\text{H}_{27}\text{N}_3\text{O}_4$ 

理論値 349.2001

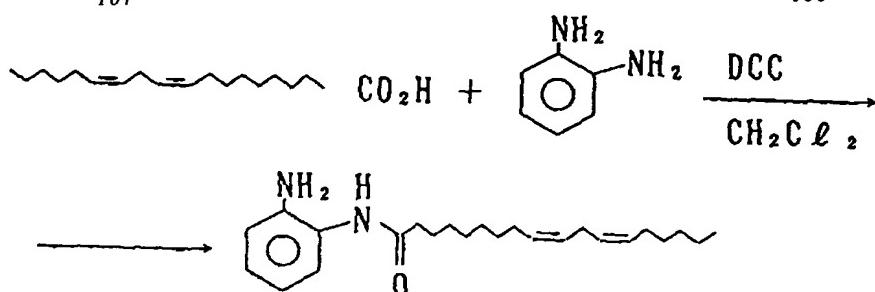
実測値 349.1993

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.99 (3H, s) , 1.03 (3H, s) , 1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 2.67 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 3.59-3.70 (2H, m) , 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.10 (1H, s) , 6.72-6.82 (2H, m) , 7.03-7.16 (2H, m) , 7.20 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.87 (1H, s)

13 m-リノレオイルアミノアニリン

(54)

107



リノール酸0.841gとo-フェニレンジアミン0.541gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシカルボジイミド1.03gを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.796g(収率72%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{CO}}$  1646

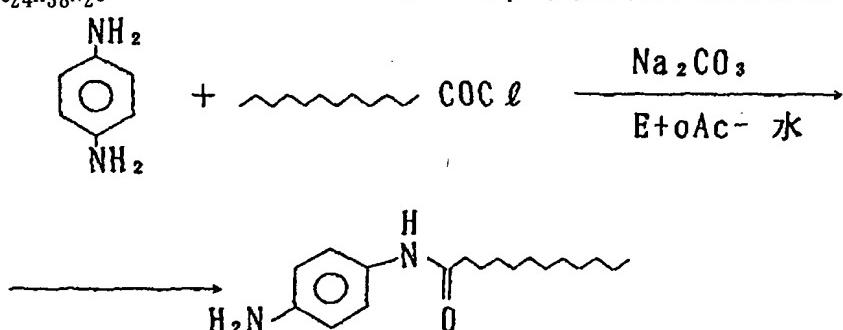
質量分析 分子式;  $C_{24}H_{38}N_2O$

10 \* 理論値 370.2984

実測値 370.2981

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.89 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
1.22-1.43 (14H, m) , 1.63-1.88 (2H, m) ,  
1.98-2.11 (4H, m) , 2.32 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
2.77 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 5.28-5.46 (4H, m) ,  
6.47 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 6.69 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) ,  
7.07 (1H, t,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.14 (1H, s) , 7.24  
(2H, s)

\* 14 p-ラウロイルアミノアニリン



p-フェニレンジアミン342mgを酢酸エチル10mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし炭酸ナトリウム106mgを添加し氷冷攪拌下に、ラウリン酸クロリド219mgを酢酸エチル10mlに溶かした溶液を滴下し、そのまま2時間攪拌した。反応終了後、有機層を分取し、有機層を水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物250g(収率86%)を得た。

性状；油状

30 \* IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{CO}}$  1651

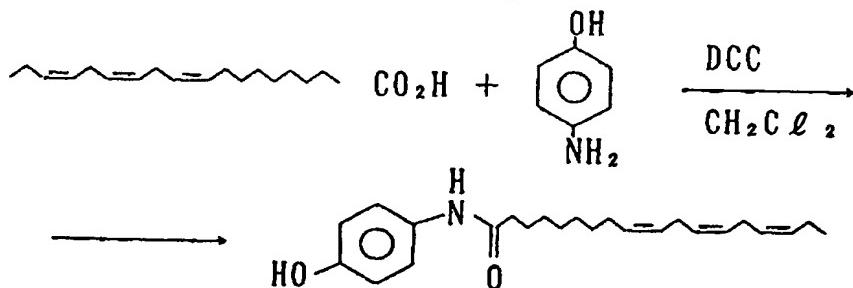
質量分析 分子式;  $C_{18}H_{30}N_2O$

理論値 290.2358

実測値 290.2362

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
1.17-1.42 (16H, m) , 1.63-1.78 (2H, m) ,  
2.31 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 3.581 (2H, brs) ,  
6.64 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ ) , 6.98 (1H, brs) , 7.26  
(2H, d,  $J=9\text{Hz}$ )

\* 15 p-リノレノイルアミノフェノール



リノレン酸835mgとp-アミノフェノール546mgとを塩化メチレン10mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシ

クロヘキシカルボジイミド618mgを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去

(55)

109

し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.03g（収率55%）を得た。

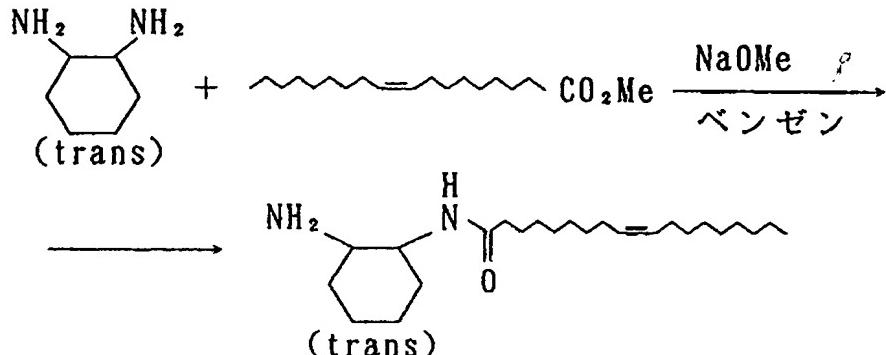
性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu$  CO 1646

質量分析 分子式;  $\text{C}_{24}\text{H}_{35}\text{NO}_2$

理論値 369.2667

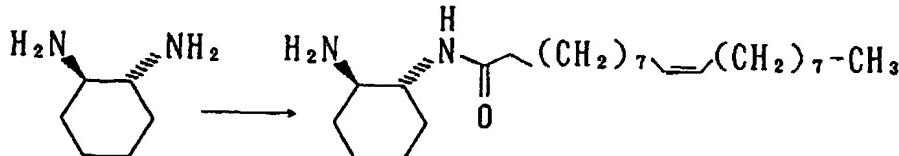
実測値 369.2672



*trans*-1,2-ジアミノシクロヘキサン1.14gとオレイ  
ン酸メチル2.96gとをベンゼン15mlに溶かし、ナトリウ  
ムメトキシド0.60gを添加し、20時間加熱還流した。反  
応終了後、溶媒を減圧下で留去し、残留物を酢酸エチル  
と水に溶かし有機層を分取した。有機層を飽和食塩水で  
洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を留去  
した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに  
供し精製し、標記化合物2.54g（収率68%）を得た。

性状；油状

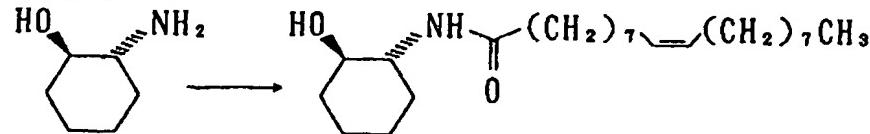
質量分析 分子式;  $\text{C}_{24}\text{H}_{46}\text{N}_2\text{O}$



(S,S)-1,2-ジアミノシクロヘキサン1.14gとオレ  
イン酸メチル2.96gとをベンゼン15mlに溶かし、ナトリ  
ウムメトキシド0.60gを添加し、20時間加熱還流した。  
反応終了後、溶媒を減圧下で留去し、残留物を酢酸エチ  
ルと水に溶かし有機層を分取した。有機層を飽和食塩水  
で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を留  
去了した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
に供し精製し、標記化合物2.41g（収率65%）を得た。

性状；油状

質量分析 分子式;  $\text{C}_{24}\text{H}_{46}\text{N}_2\text{O}$



(1R,2R)-2-アミノシクロヘキサノール1.15gを酢  
酸エチル10ml及び水10mlに溶かし氷冷攪拌下に、オレイ

110

\* NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.97 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
1.19-1.44 (8H, m) , 1.56-1.77 (2H, m) ,  
1.98-2.12 (4H, m) , 2.33 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
2.71-2.88 (4H, m) , 5.26-5.45 (6H, m) ,  
6.77 (2H, d,  $J=9\text{Hz}$ ) , 7.05 (1H, s) , 7.31  
(2H, d,  $J=9\text{Hz}$ )

16 *trans*-2-(オレオイレアミノ)シクロヘキシルア

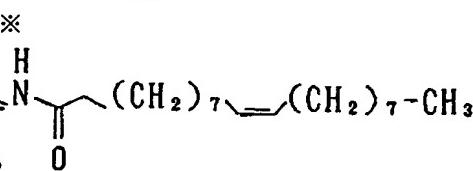
\* ミン

20 \* 理論値 378.3610

実測値 378.3611

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
1.12-1.48 (24H, m) , 1.53-1.79 (4H, m) ,  
1.91 (6H, m) , 2.18-2.35 (2H, m) , 2.52-  
2.95 (3H, m) , 3.62-3.78 (1H, m) , 5.28-  
5.40 (2H, m) , 6.08-6.20 (1H, m)

17 (1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキシ  
ルアミン

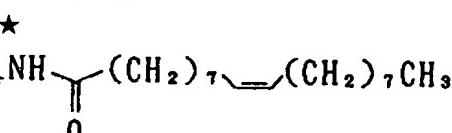


★ 理論値 378.3610

実測値 378.3612

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
1.12-1.48 (24H, m) , 1.53-1.79 (4H, m) ,  
1.91 (6H, m) , 2.18-2.35 (2H, m) , 2.52-  
2.95 (3H, m) , 3.62-3.78 (1H, m) , 5.28-  
5.40 (2H, m) , 6.08-6.20 (1H, m)

18 (1R,2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサ  
ノール



ン酸クロリド3.0gを酢酸エチル20mlに溶かした溶液を滴  
下し、滴下終了後3時間攪拌した。反応終了後、水層を

(56)

111

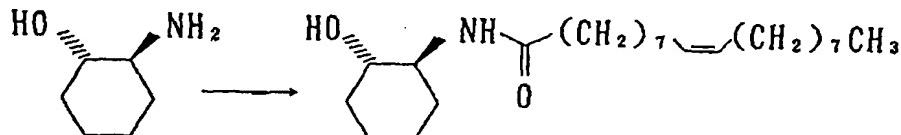
除去し、有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.74g（収率99%）を得た。

性状；油状

質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>45</sub>N<sub>0</sub><sub>2</sub>

理論値 379.3450

実測値 379.3453



(1S, 2S) - 2 - アミノシクロヘキサノール1.15gを酢酸エチル10ml及び水10mlに溶かし氷冷攪拌下に、オレイン酸クロリド3.0gを酢酸エチル20mlに溶かした溶液を滴下し、滴下終了後3時間攪拌した。反応終了後、水層を除去し、有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.76g（収率99%）を得た。

性状；油状

質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>45</sub>N<sub>0</sub><sub>2</sub>

112

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.10-1.42 (24H, m), 1.57-1.78 (4H, m), 1.89-2.10 (6H, m), 2.22 (2H, t, J=7Hz), 3.32 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 5Hz), 3.58-3.70 (1H, m), 5.28-5.50 (3H, m)  
19 (1S, 2S) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサンノール

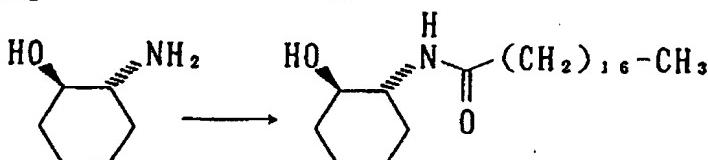
\*

※ 理論値 379.3450

実測値 379.3453

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.10-1.42 (24H, m), 1.57-1.78 (4H, m), 1.89-2.10 (6H, m), 2.22 (2H, t, J=7Hz), 3.32 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 5Hz), 3.58-3.70 (1H, m), 5.28-5.50 (3H, m)  
20 (1R, 2R) - 2 - (ステアロイルアミノ) シクロヘキサンノール

※



(1R, 2R) - 2 - アミノシクロヘキサノール1.15gを酢酸エチル10ml及び水10mlに溶かし氷冷攪拌下に、ステアリン酸クロリド3.02gを酢酸エチル20mlに溶かした溶液を滴下し、滴下終了後3時間攪拌した。反応終了後、水層を除去し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.0g（収率100%）を得た。

性状；油状

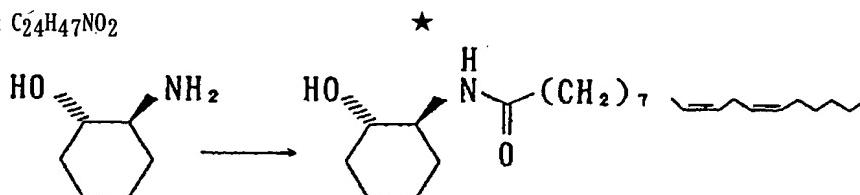
質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>47</sub>N<sub>0</sub><sub>2</sub>

★ 理論値 381.3606

実測値 381.3611

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.11-1.41 (32H, m), 1.57-1.78 (4H, m), 1.89-2.11 (2H, m), 2.22 (2H, t, J=7Hz), 3.31 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 5Hz), 3.58-3.70 (1H, m), 5.42-5.51 (1H, m)  
21 (1S, 2S) - 2 - (リノレオイルアミノ) シクロヘキサンノール

★



(1S, 2S) - 2 - アミノシクロヘキサノール1.15gを酢酸エチル10ml及び水10mlに溶かし氷冷攪拌下に、リノール酸クロリド2.98gを酢酸エチル20mlに溶かした溶液を滴下し、滴下終了後3時間攪拌した。反応終了後、水層を除去し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記

化合物3.76g（収率100%）を得た。

性状；油状

質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>43</sub>N<sub>0</sub><sub>2</sub>

理論値 377.3293

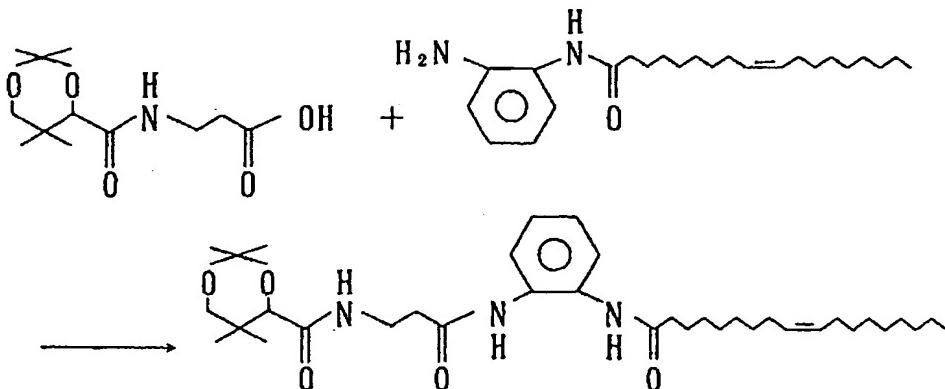
実測値 377.3299

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz), 1.12-1.41 (18H, m), 1.58-1.77 (4H, m), 50

(57)

113

1.89-2.18 (6H, m)、2.22 (2H, t, J=8Hz)、  
2.77 (2H, t, J=6Hz)、3.31 (2H, ddd, J=11Hz,  
11Hz, 5Hz)、3.59-3.70 (1H, m)、5.29-  
5.47 (5H, m)



2-アミノオレオイルアニリド-372mgと3-(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ)プロピオン酸259mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド211mgを加え、そのまま1夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物500mg(収率82%)を得た。

性状；油状

施光度  $[\alpha]_D$  ; +29.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1664質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 613.4454

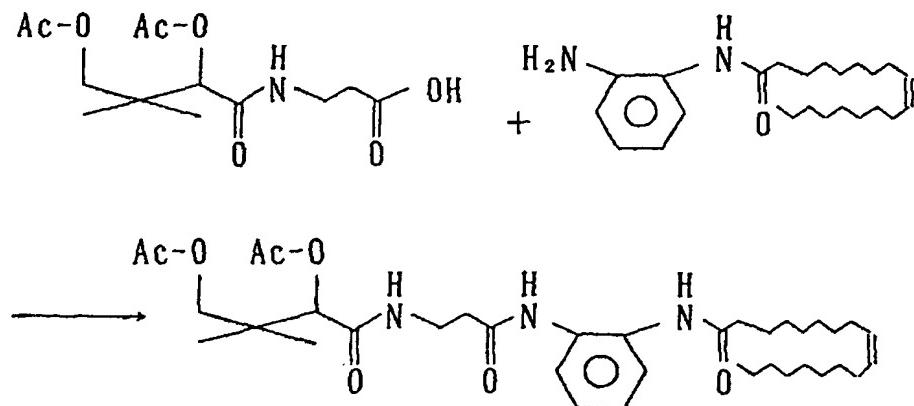
実測値 613.4425

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz)、  
0.98 (3H, s)、1.04 (3H, s)、1.22-1.40  
(20H, m)、1.42 (3H, s)、1.45 (3H, s)、  
1.62-1.77 (2H, m)、1.94-2.09 (4H, m)、  
2.36 (2H, t, J=7Hz)、2.60 (2H, t, J=6Hz)、  
3.28 (1H, d, J=12Hz)、3.55-3.66 (2H, m)、  
3.69 (1H, d, J=12Hz)、4.10 (1H, s)、  
5.29-5.42 (2H, m)、7.14-7.48 (2H, m)、  
7.39-7.48 (2H, m)、8.18 (1H, s)、8.60  
(1H, brs)

実施例-2

N-(2-(オレオイルアミノ)フェニル)-3-(N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ)プロパンアミド

※



○-オレオイルアミノアニリン744mgと3-(N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ)プロピオン酸600mgとを塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷攪拌下、塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド442mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留

物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物810mg(収率62%)を得た。

性状；油状

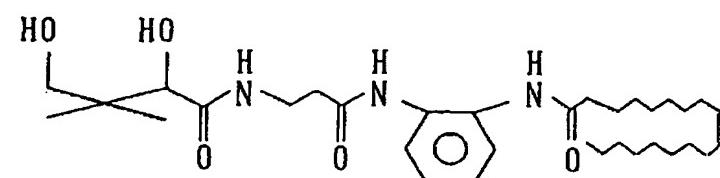
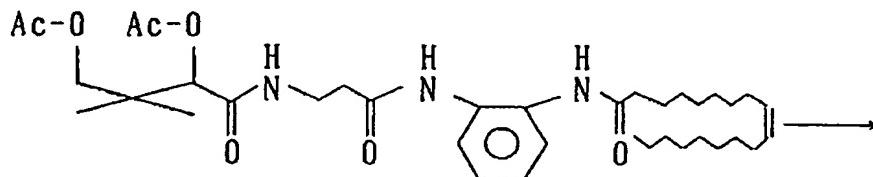
施光度  $[\alpha]_D$  ; +6.30° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1750, 1660質量分析 分子式; C<sub>37</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 657.4352

(58)

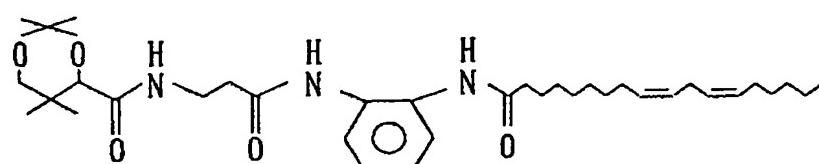
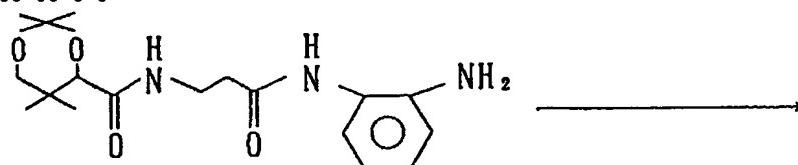
115

実測値 657.4369  
 NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 1.02 (3H, s) , 1.06 (3H, s) , 1.23-1.45 (20H, m) , 1.67-1.79 (2H, m) , 1.95-2.09 (4H, m) , 2.03 (2H, s) , 2.04 (3H, s) , 2.42 (2H, t, J=7Hz) , 2.58 (2H, t, J=6Hz) , 3.49-3.72 (2H, m) , 3.83 (2H, d, J=11Hz) , 4.02 (1H, d, J=11Hz) , 4.89 (1H, s) , 5.30



N - [2 - (オレオイルアミノ) フェニル] - 3 - [N - (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド470mgをメタノール4mlに溶かし、室温攪拌下に、1Nカセイソーダ水溶液1.5mlを加えさらに30分間攪拌した。反応終了後、水10mlを加え塩化メチレン20mlで抽出した。塩化メチレン層を水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去の後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物377mg (収率94%)を得た。

性状；油状

施光度 [ $\alpha$ ] D ; +21.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu$  C=01660質量分析 分子式 ; C<sub>33</sub>H<sub>55</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

N - (2-アミノフェニル) - 3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド349mgとリノール酸280mgとジシクロヘキシリカルボジイミド227mgとトルエン15mlに

116

\* - 5.44 (2H, m) , 6.72-6.81 (1H, m) , 7.19-7.32 (2H, m) , 7.37 (1H, d, J=8Hz) , 7.59 (1H, d, J=8Hz) , 7.88 (1H, brs) , 8.19 (1H, brs)

実施例-3

N - [2 - (オレオイルアミノ) フェニル] - 3 - [N - (2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド

\*

※ 理論値 573.4141

実測値 573.4146

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.90 (3H, s) , 0.97 (3H, s) , 1.20-1.42 (20H, m) , 1.62-1.76 (2H, m) , 1.94-2.01 (4H, m) , 2.38 (2H, t, J=7Hz) , 2.52 (2H, t, J=6Hz) , 3.44 (2H, s) , 3.49-3.72 (2H, m) , 3.94 (1H, s) , 5.28-5.42 (2H, m) , 7.13-7.21 (2H, m) , 7.29-7.49 (3H, m) , 8.31 (1H, s) , 8.69 (1H, s)

実施例-4

N - [2 - (リノレオイルアミノ) フェニル] - 3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド

\*

溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後生じた結晶を濾過し、ろ液を濃縮し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物266mg (収率44%)を得た。

50

(59)

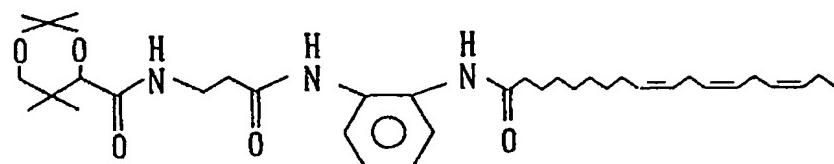
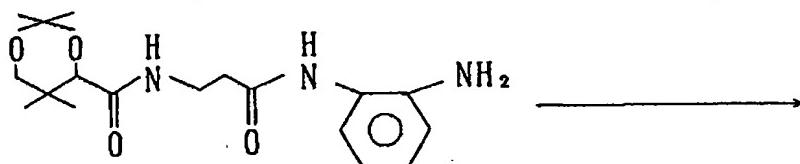
117

性状；油状

施光度  $[\alpha]_D$  ; +27.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1662質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>57</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 611.4298

実測値 611.4264

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.23-1.44 (14H, m), 1.42 (3H, s), 1.45 (3H, s), 1.65-1.77 (2H, m), 1.91-2.10 (4H, m),

性状；油状  
施光度  $[\alpha]_D$  ; +26.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)  
IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1660  
質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>55</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>  
理論値 609.4141  
実測値 609.4144

※ NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.97 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.23-1.43 (8H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.65-1.77 (2H, m), 2.03-2.12 (4H, m), 2.38 (2H, t, J=7Hz), 2.63 (2H, t, J=6Hz), 2.75-2.83 (4H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.58-3.70 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.11 (1H, s), 5.29-5.43 (6H, m), 7.09 (1H, t, J=6Hz), 7.17-7.22 (2H, m), 7.42-7.51 (2H, m), 8.06 (1H, brs), 8.51 (1H, brs)

118

\* 2.37 (2H, t, J=7Hz), 2.62 (2H, t, J=6Hz), 2.77 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.56-3.67 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.10 (1H, s), 5.29-5.44 (4H, m), 7.09 (1H, t, J=6Hz), 7.15-7.22 (2H, m), 7.42-7.49 (2H, m), 8.11 (1H, s), 8.55 (1H, s)

実施例-5

N-[(2-(リノレノイルアミノ)フェニル)-3-[(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ)プロパンアミド]

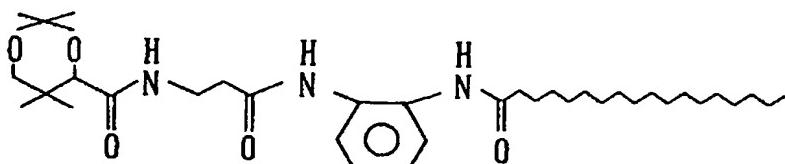
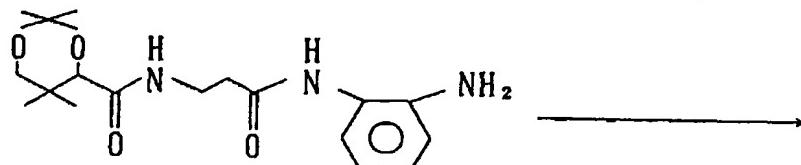
\*<sup>10</sup> 10 -カルボニル)アミノ]プロパンアミド

※ NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.97 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.23-1.43 (8H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.65-1.77 (2H, m), 2.03-2.12 (4H, m), 2.38 (2H, t, J=7Hz), 2.63 (2H, t, J=6Hz), 2.75-2.83 (4H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.58-3.70 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.11 (1H, s), 5.29-5.43 (6H, m), 7.09 (1H, t, J=6Hz), 7.17-7.22 (2H, m), 7.42-7.51 (2H, m), 8.06 (1H, brs), 8.51 (1H, brs)

実施例-6

N-[(2-(ステアロイルアミノ)フェニル)-3-[(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ)プロパンアミド]

※ 10 -カルボニル)アミノ]プロパンアミド



N-[(2-(アミノフェニル)-3-[(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)

アミノ)プロパンアミド]349mgを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷攪拌下にピリジン1ml、次いで、ステアリン

(60)

119

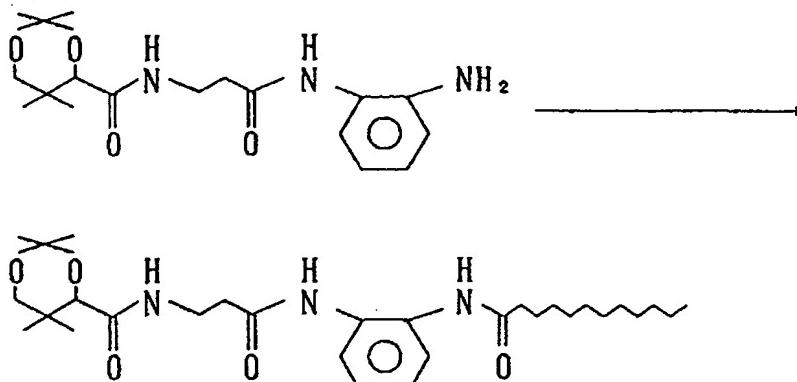
酸クロリド303mgを塩化メチレン3mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去したのち、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物507mg（収率82%）を得た。

性状；油状

施光度  $[\alpha]_D$  ; +27.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C</sub>=01664質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>61</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 615.4611

実測値 615.4582

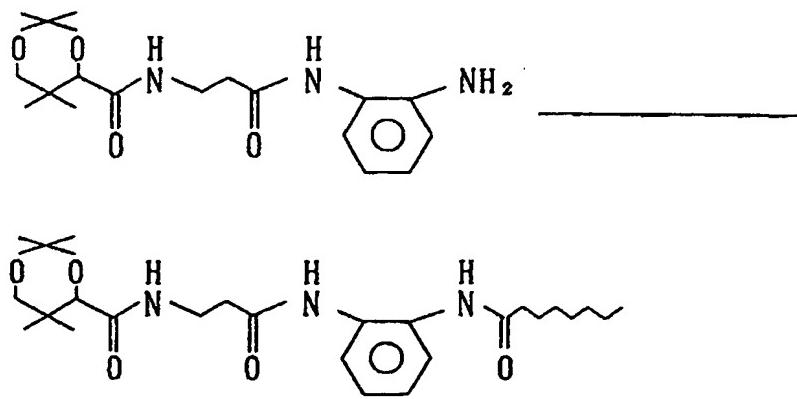
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,

30 N - (2 - アミノフェニル) - 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロパンアミド349mgを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷攪拌下にピリジン1ml、次いで、ラウリン酸クロリド219mgを塩化メチレン3mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物454mg（収率86%）を得た。

性状；油状

施光度  $[\alpha]_D$  ; +31.7° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C</sub>=01664質量分析 分子式; C<sub>30</sub>H<sub>49</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 531.3672



120

\* 0.98 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.43 (28H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 1.68-1.78 (2H, m) , 2.40 (2H, t, J=7Hz) , 2.65 (2H, t, J=6Hz) , 3.28 (1H, d, J=12Hz) , 3.58-3.72 (2H, m) , 3.69 (1H, d, J=12Hz) , 4.11 (1H, s) , 7.08 (1H, t, J=6Hz) , 7.17-7.23 (2H, m) , 7.42-7.53 (2H, m) , 8.00 (1H, s) , 8.49 (1H, s)

実施例-7

10 N - [2 - (ラウロイルアミノ) フェニル] - 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロパンアミド

\* N - (2 - アミノフェニル) - 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロパンアミド

実測値 531.3692

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.98 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.21-1.43 (16H, m) , 1.42 (3H, s) , 1.45 (3H, s) , 1.65-1.77 (2H, m) , 2.38 (2H, t, J=7Hz) , 2.61 (2H, t, J=6Hz) , 3.28 (1H, d, J=12Hz) , 3.55-3.68 (2H, m) , 3.69 (1H, d, J=12Hz) , 4.10 (1H, s) , 7.09 (1H, t, J=12Hz) , 7.14-7.22 (2H, m) , 7.40-7.49 (2H, m) , 8.13 (1H, s) , 8.57 (1H, s)

実施例-8

N - [2 - (オクタノイルアミノ) フェニル] - 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロパンアミド

(61)

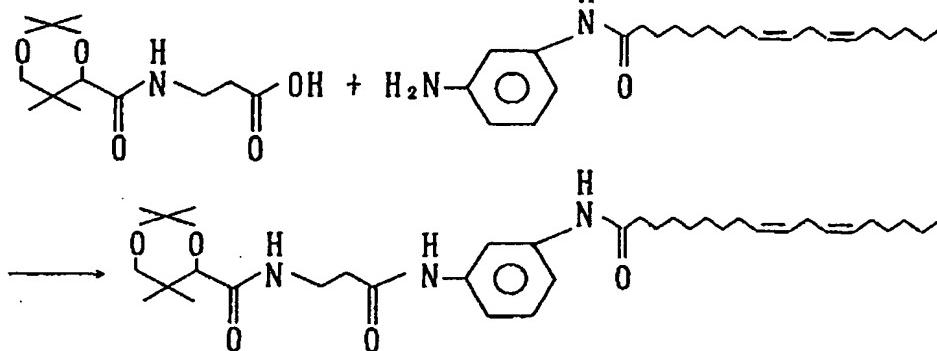
121

N-(2-アミノフェニル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド349mgを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷攪拌下にピリジン1ml、次いで、オクタン酸クロリド163mgを塩化メチレン3mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物413mg(収率87%)を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]_D$  ; +35.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; νC=O 1664質量分析 分子式; C<sub>26</sub>H<sub>41</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 475.3046



3-リノレオイルアミノアニリン555mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸389mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド316mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物786mg(収率86%)を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]_D$  ; +30.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; νC=O 1664質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>57</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 611.4298

実測値 611.4389

(61)

122

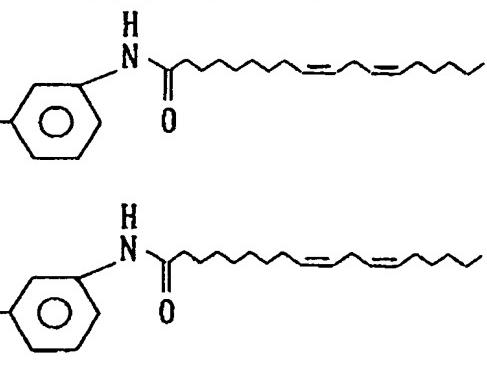
\* 実測値 475.3039

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz)、0.98 (3H, s)、1.04 (3H, s)、1.23-1.38 (8H, m)、1.42 (3H, s)、1.45 (3H, s)、1.62-1.77 (2H, m)、2.37 (2H, t, J=7Hz)、2.60 (2H, t, J=6Hz)、3.28 (1H, d, J=12Hz)、3.57-3.71 (2H, m)、3.69 (1H, d, J=12Hz)、4.10 (1H, s)、7.09 (1H, t, J=6Hz)、7.14-7.21 (2H, m)、7.40-7.49 (2H, m)、8.16 (1H, s)、8.59 (1H, s)

実施例-9

N-[3-(リノレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

\* -



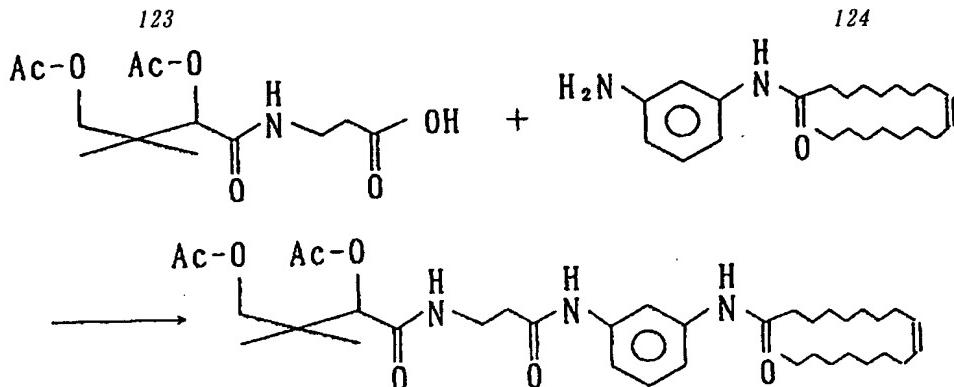
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz)、0.96 (3H, s)、1.03 (3H, s)、1.23-1.42 (14H, m)、1.41 (3H, s)、1.45 (3H, s)、1.62-1.78 (2H, m)、1.99-2.08 (4H, m)、2.33 (2H, t, J=7Hz)、2.64 (2H, t, J=6Hz)、2.77 (2H, t, J=6Hz)、3.26 (1H, d, J=12Hz)、3.52-3.73 (2H, m)、3.68 (1H, d, J=12Hz)、4.11 (1H, s)、5.29-5.43 (2H, m)、7.09 (1H, t, J=6Hz)、7.22-7.29 (2H, m)、7.34-7.42 (2H, m)、7.79 (1H, s)、8.36 (1H, brs)

実施例-10

N-[3-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

\* -

(62)



m-オレオイルアミノアニリン744mgと3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオン酸606mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド422mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物860mg(収率65%)を得た。

性状；油状

施光度  $[\alpha]$  D ; +12.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν C=01750, 1668

質量分析 分子式 ; C<sub>37</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 657.4352

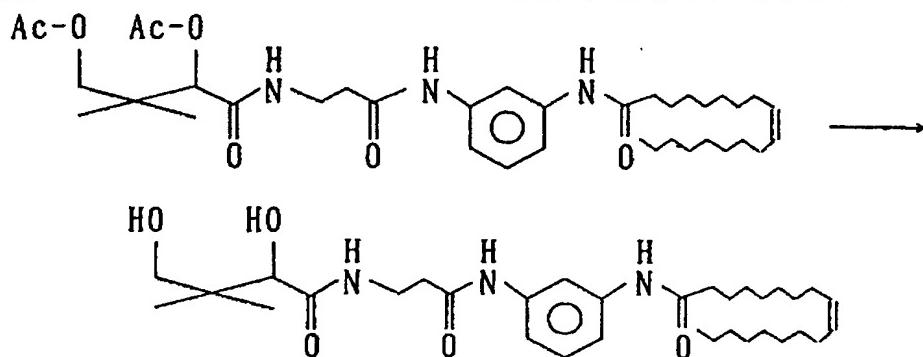
実測値 657.4342

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz) , 1.03 (3H, s) , 1.05 (3H, s) , 1.21-1.42 (20H, m) , 1.61-1.77 (2H, m) , 1.97-2.13 (4H, m) , 2.05 (3H, s) , 2.10 (3H, s) , 2.33 (2H, t, J=7Hz) , 2.56 (2H, t, J=6Hz) , 3.55-3.68 (2H, m) , 3.87 (1H, d, J=11Hz) , 4.02 (1H, d, J=10Hz) , 4.91 (1H, s) , 5.29 - 5.42 (2H, m) , 6.84 (1H, d, J=6Hz) , 7.25 (1H, d, J=8Hz) , 7.33 (1H, d, J=8Hz) , 7.41 (1H, d, J=8Hz) , 7.54 (1H, brs) , 7.63 (1H, brs) , 8.01 (1H, brs)

#### 実施例-11

N-[3-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

\*



N-[3-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド470mgをメタノール4mlに溶かし、室温攪拌下に、1Nカセイソーダ水溶液1.5mlを加え、さらに30分間攪拌した。反応終了後、水10mlを加え塩化メチレン20mlで抽出した。塩化メチレン層を水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去の後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物378mg(収率94%)を得た。

性状；油状

施光度  $[\alpha]$  D ; +23.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν C=01660

質量分析 分子式 ; C<sub>33</sub>H<sub>55</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 573.4141

実測値 573.4146

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.91 (3H, s) , 0.98 (3H, s) , 1.21-1.42 (20H, m) , 1.62-1.73 (2H, m) , 1.93-2.10 (4H, m) , 2.32 (2H, t, J=7Hz) , 2.52 (2H, brs) , 3.50-3.70 (2H, m) , 4.01 (1H, s) , 5.29-5.43 (2H, m) , 7.17-7.31 (3H, m) , 7.53-7.62 (1H, m) , 7.71 (1H, brs) , 7.92-8.00 (1H, m) , 8.46-8.55 (1H, m)

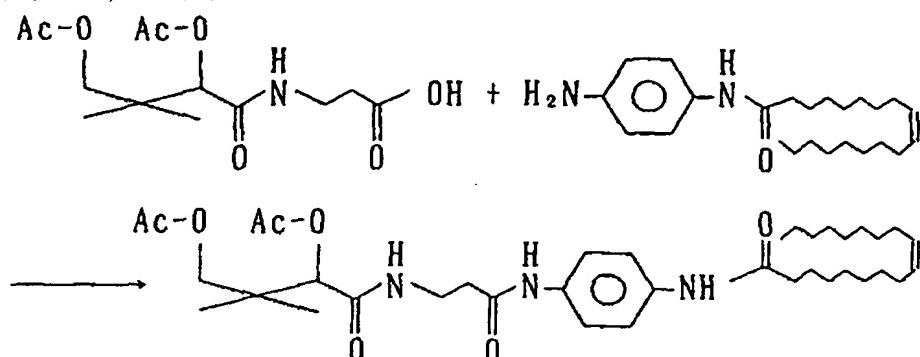
#### 実施例-12

N-[4-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-

50

(63)

125  
- (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ】プロパンアミド  
126



p-オレオイルアミノアニリン744mgと3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ]プロピオン酸606mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド422mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物900mg(収率69%)を得た。

性状；油状

施光度  $[\alpha]$  D ; +17.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu$  C=01754, 1660

質量分析 分子式 ; C<sub>37</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 657.4352

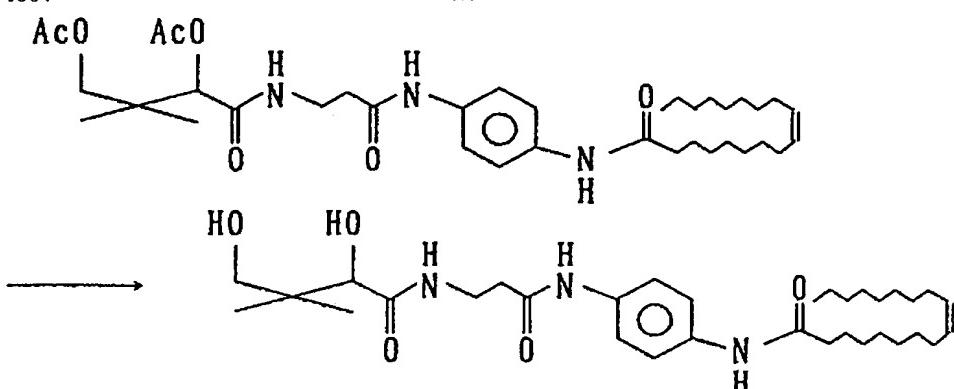
実測値 657.4357

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
1.02 (3H, s) , 1.05 (3H, s) , 1.19-1.43  
(20H, m) , 1.66-1.77 (2H, m) , 1.92-  
2.09 (4H, m) , 2.05 (3H, s) , 2.08 (3H, s) ,  
2.34 (2H, t, J=7Hz) , 2.56 (2H, t, J=6Hz) ,  
3.50-3.71 (2H, m) , 3.84 (1H, d, J=11Hz) ,  
4.02 (1H, d, J=11Hz) , 4.89 (1H, s) ,  
5.29-5.42 (2H, m) , 6.76 (1H, t, J=6Hz) ,  
7.13 (1H, brs) , 7.44-7.52 (4H, m) , 7.64  
(1H, brs)

#### 実施例-13

N-[4-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

※



N-[4-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド657mgをメタノール4mlに溶かし、室温攪拌下に、1Nカセイソーダ水溶液1.5mlを加え、さらに30分間攪拌した。反応終了後、水10mlを加え塩化メチレン20mlで抽出した。塩化メタレン層を水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去の後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物495mg(収率86%)を得た。

性状；融点 146.2~148.1°C

施光度  $[\alpha]$  D ; +10.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu$  C=01664

質量分析 分子式 ; C<sub>37</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 573.4141

実測値 573.4144

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
0.89 (3H, s) , 0.95 (3H, s) , 1.15-1.43  
(20H, m) , 1.62-1.77 (2H, m) , 1.92-  
2.08 (4H, m) , 2.34 (2H, t, J=7Hz) , 2.56  
(2H, brs) , 3.45 (2H, s) , 3.58 (2H, brs) ,  
3.96 (1H, s) , 5.27-5.42 (2H, m) , 7.25-  
7.39 (4H, m) , 7.48 (1H, brs) , 7.71 (1H,  
brs) , 8.54 (1H, brs)

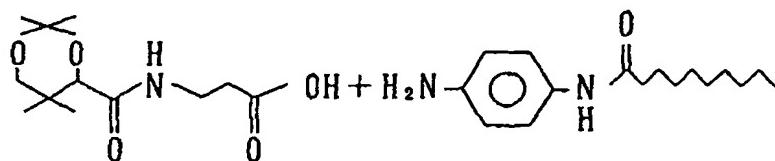
(64)

127

## 実施例-14

N-(4-(ラウロイルアミノ)フェニル)-3-[N\*

\*-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド



4-ラウロイルアミノアニリン250mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸223mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸 1エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド181mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物381mg(収率72%)を得た。

性状；融点 144.3~144.9℃

施光度  $[\alpha]$  D ; +34.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν C=0 1664質量分析 分子式; C<sub>30</sub>H<sub>49</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

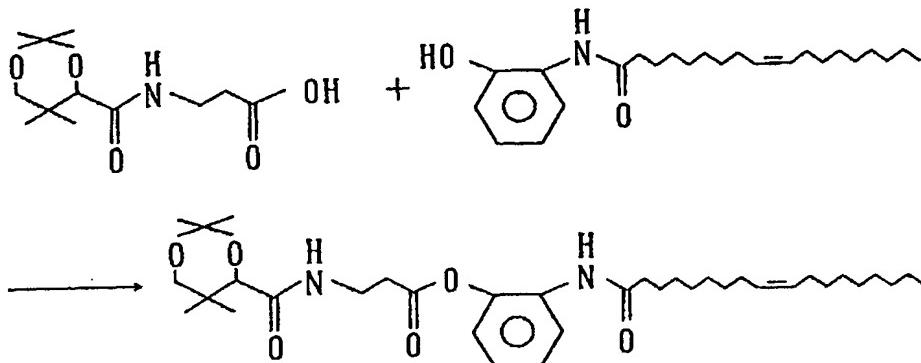
理論値 531.3672

※ 実測値 531.3675

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.95 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.22-1.40 (16H, m) , 1.41 (3H, s) , 1.45 (3H, s) , 1.68-1.80 (2H, m) , 2.34 (2H, t, J=7Hz) , 2.65 (2H, t, J=6Hz) , 3.27 (1H, d, J=12Hz) , 3.50-3.75 (2H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) , 4.10 (1H, s) , 7.08 (1H, d, J=6Hz) , 7.16 (1H, s) , 7.46 (2H, d, J=8Hz) , 7.49 (2H, d, J=8Hz) , 8.09 (1H, s)

## 実施例-15

2-(オレオイルアミノ)フェニル-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート



2-オレオイルアミノフェノール303mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸259mgとジシクロヘキシリカルボジイミド227mg及び4-ジメチルアミノピリジン122mgとをトルエン15mlに溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後生じた結晶を濾過して除き、ろ液を濃縮し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物445mg(収率72%)を得た。

性状；油状

施光度  $[\alpha]$  D ; +26.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν C=0 1772, 1658質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 614.4294

実測値 614.4271

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.99 (3H, s) , 1.00 (3H, s) , 1.22-1.43 (20H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) , 1.65-1.78 (2H, m) , 1.93-2.08 (4H, m) , 2.44 (2H, t, J=7Hz) , 2.80 (2H, t, J=6Hz) , 3.28 (1H, d, J=12Hz) , 3.69-3.82 (2H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) , 4.09 (1H, s) , 5.29-5.39 (2H, m) , 7.00 (1H, t, J=6Hz) , 7.06-7.12 (2H, m) , 7.19-7.27 (1H, m) , 8.22 (1H, d, J=8Hz) , 8.39 (1H, s)

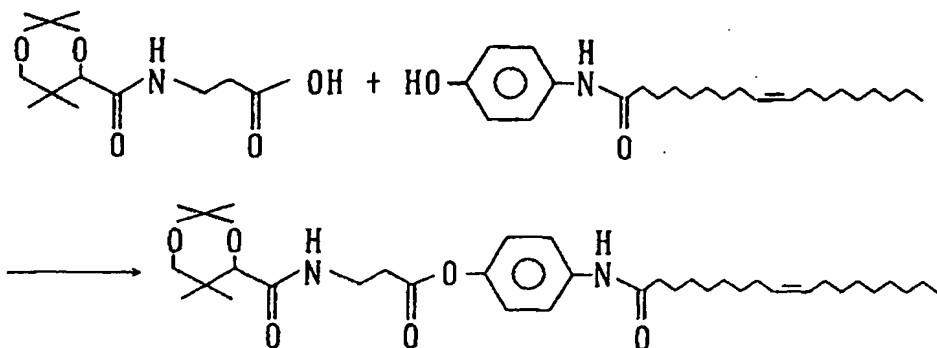
(65)

129

## 実施例-16

4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,2,\*

\*5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート



p-ヒドロキシオレオイルアニド565mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオニ酸393mgとジシクロヘキシリルカルボジイミド345mg及び4-ジメチルアミノピリジン204mgとをトルエン15mlに溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後生じた結晶を濾過して除き、ろ液を濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物930mg（収率99%）を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]$  D ; +18.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C</sub>=01760, 1662質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

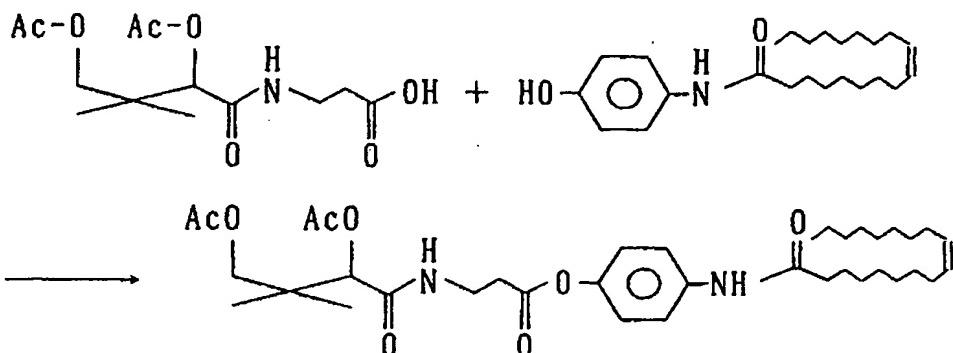
理論値 614.4294

実測値 614.4312

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz)、  
1.00 (3H, s)、1.06 (3H, s)、1.23-1.43  
(20H, m)、1.43 (3H, s)、1.45 (3H, s)、  
1.65-1.78 (2H, m)、1.93-2.09 (4H, m)、  
2.35 (2H, t, J=7Hz)、2.82 (2H, t, J=6Hz)、  
3.29 (1H, d, J=12Hz)、3.52-3.77 (2H, m)、  
3.70 (1H, d, J=12Hz)、4.11 (1H, s)、5.29  
- 5.41 (2H, m)、6.98-7.07 (1H, m)、7.03  
(2H, d, J=8Hz)、7.54 (2H, d, J=8Hz)、7.18  
(1H, s)

## 実施例-17

4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート



p-オレオイルアミノフェノール372mgと3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオニ酸259mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド211mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物255mg（収率39%）を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]$  D ; +19.4° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C</sub>=01750, 1666質量分析 分子式; C<sub>37</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>8</sub>

理論値 658.4193

実測値 658.4191

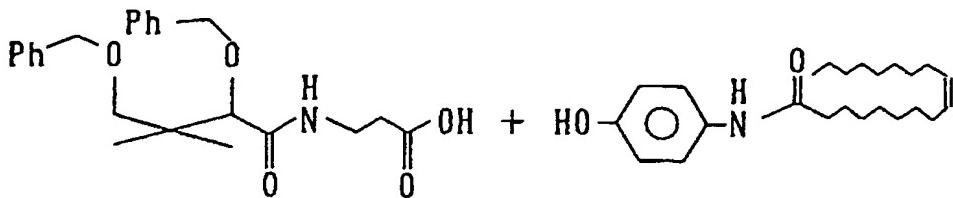
40 NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz)、  
1.03 (3H, s)、1.08 (3H, s)、1.22-1.42  
(20H, m)、1.66-1.78 (2H, m)、1.96-  
2.07 (4H, m)、2.01 (3H, s)、2.04 (3H, s)、  
2.35 (2H, t, J=7Hz)、2.77-2.82 (2H, m)、  
3.84 (1H, d, J=12Hz)、4.05 (1H, d, J=12Hz)、  
4.97 (1H, s)、5.27-5.42 (2H, m)、6.61  
(1H, t, J=6Hz)、7.04 (2H, d, J=8Hz)、7.15  
(1H, brs)、7.54 (2H, d, J=8Hz)

## 実施例-18

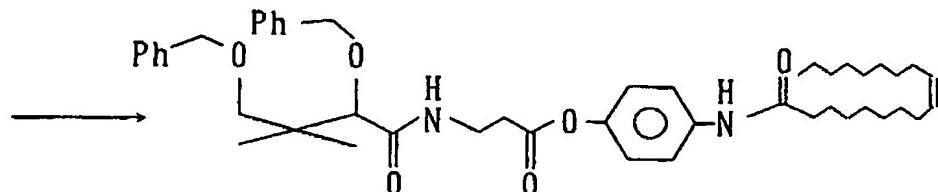
50 4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,4-

(66)

131

-ジベンジルオキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ<sup>\*</sup>\*ル)アミノ]プロピオネート

132



3-[N-(2,4-ジベンジルオキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオニ酸200mgと4-(オレオイルアミノ)フェノール186mgとジシクロヘキシカルボジイミド124mg及び4-ジメチルアミノビリジン67mgとをトルエン15mlに溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後、生じた結晶を濾過し、ろ液を濃縮し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物312mg(収率97%)を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]$ <sub>D</sub>；+19.3°(C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR(cm<sup>-1</sup>, neat) ; νC=01760, 1652質量分析 分子式; C<sub>47</sub>H<sub>66</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 754.4920

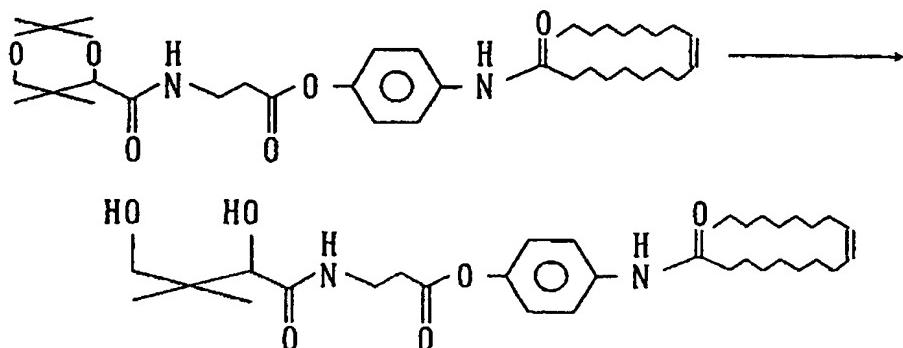
実測値 754.4890

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz)、  
0.94 (3H, s)、1.05 (3H, s)、1.20-1.41  
(20H, m)、1.64-1.75 (2H, m)、1.95-  
2.09 (4H, m)、2.34 (3H, s)、2.75 (3H, t,  
J=7Hz)、3.23 (1H, t, J=9Hz)、3.61 (2H, dd,  
J=6Hz)、3.41 (1H, d, J=9Hz)、3.90 (1H, s)、  
4.34-4.55 (4H, m)、5.29-5.42 (2H, m)、  
6.95 (2H, d, J=8Hz)、7.03 (1H, d, J=8Hz)、  
7.23-7.39 (10H, m)、7.50 (2H, d, J=8Hz)

## 実施例-19

4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート

※



4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニルアミノ)プロピオネート500mgを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後、水20mlを加え塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を水洗し無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物395mg(収率85%)を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]$ <sub>D</sub>；+14.3°(C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR(cm<sup>-1</sup>, neat) ; νC=01758, 1662質量分析 分子式; C<sub>33</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 574.3981

実測値 574.3952

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz)、  
0.93 (3H, s)、1.03 (3H, s)、1.21-1.43  
(20H, m)、1.65-1.71 (2H, m)、1.71-  
2.18 (6H, m)、2.35 (2H, t, J=7Hz)、2.82  
(2H, t, J=6Hz)、3.50 (1H, d, J=10Hz)、  
3.60-3.74 (2H, m)、3.54 (1H, d, J=10Hz)、  
4.04 (1H, s)、5.28-5.43 (2H, m)、7.15-  
7.26 (2H, m)、7.04 (2H, d, J=8Hz)、7.52  
(2H, d, J=8Hz)

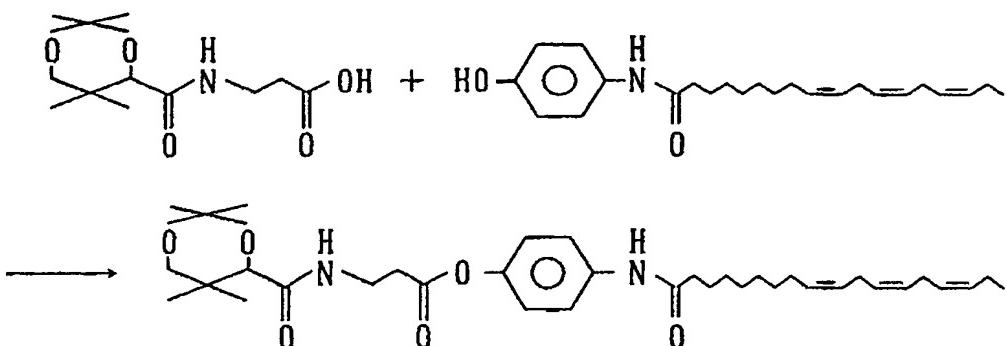
## 実施例-20

4-(リノレノイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ

(67)

133

ル) アミノ] プロピオネート



4-リノレノイルアミノフェノール369mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸259mgとジシクロヘキシリカルボジイミド227mg及び4-ジメチルアミノピリジン122mgとをトルエン15mlに溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後生じた結晶を濾過して除き、ろ液を濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物431mg(収率71%)を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]_D$  ; +20.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1760, 1662質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>52</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 608.3825

実測値 608.3836

(67)

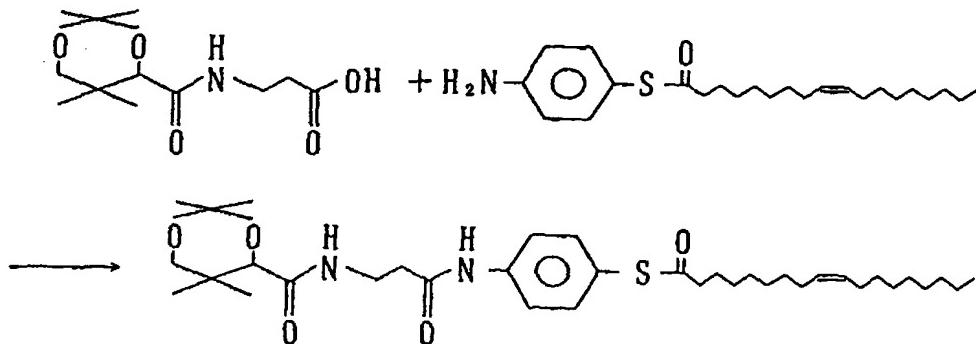
134

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.98 (3H, t, J=7Hz)、  
1.00 (3H, s)、1.06 (3H, s)、1.24-1.42  
(8H, m)、1.43 (3H, s)、1.45 (3H, s)、1.64  
- 1.78 (2H, m)、2.01-2.12 (4H, m)、2.35  
(2H, t, J=7Hz)、2.72-2.86 (6H, m)、3.29  
(1H, d, J=12Hz)、3.52-3.77 (2H, m)、  
3.70 (1H, d, J=12Hz)、4.11 (1H, s)、5.28  
- 5.44 (6H, m)、7.00 (1H, t, J=6Hz)、7.03  
- 7.15 (1H, s)、7.54 (2H, d,  
J=8Hz)

## 実施例-21

N-[4-(オレオイルチオ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

\*



S-4-アミノフェニルチオオレエート778mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸518mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸1-エチル-3-(ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド422mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物1.05g(収率83%)を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]_D$  ; +29.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1696, 1666質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S

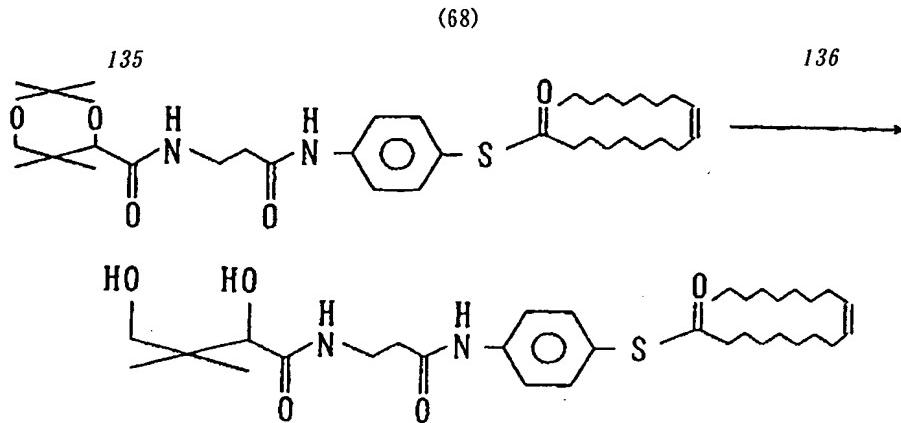
理論値 630.4066

実測値 630.4069

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz)、  
0.90 (3H, s)、1.04 (3H, s)、1.22-1.39  
(20H, m)、1.42 (3H, s)、1.46 (3H, s)、  
1.60-1.74 (2H, m)、1.92-2.09 (4H, m)、  
2.63 (2H, t, J=7Hz)、2.68 (2H, t, J=6Hz)、  
3.28 (1H, d, J=12Hz)、3.54-3.75 (2H, m)、  
3.68 (1H, d, J=12Hz)、4.10 (1H, s)、5.30  
- 5.42 (2H, m)、7.08 (1H, t, J=6Hz)、7.35  
(2H, d, J=8Hz)、7.63 (2H, d, J=8Hz)、8.29  
(1H, s)

## 実施例-22

N-[4-(オレオイルチオ)フォニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド



N-[4-(オレオイルチオ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド500mgを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後、水20mlを加え塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を水洗し無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物406mg(収率87%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$  ;  $+16.0^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu \approx 1670$

質量分析 分子式： $C_{33}H_{54}N_2O_5S$

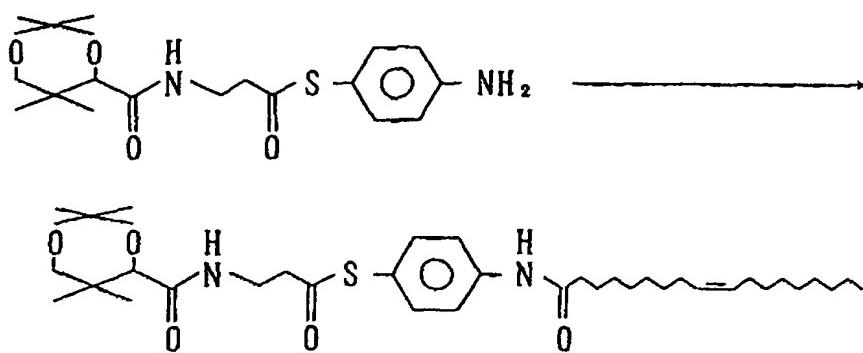
理論值 590.3753

実測値 590.3731

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>): 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.91 (3H, s), 0.98 (3H, s), 1.20-1.42 (20H, m), 1.65-1.77 (2H, m), 1.93-2.09 (4H, m), 2.57 (2H, t, J=6Hz), 2.66 (2H, t, J=6Hz), 3.25 (2H, brs), 3.48 (2H, brs), 3.50-3.69 (2H, m), 4.01 (1H, s), 5.30-5.42 (2H, m), 7.28 (2H, d, J=9Hz), 7.50 (2H, d, J=9Hz), 7.54 (2H, d, J=6Hz), 8.62 (1H, s)

20 実施例-23

S - [4 - (オレオイルアミノ) フエニル] 3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンチオエート



S-4-アミノフェニル 3-[N-2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンチオエート 281mgを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷攪拌下にピリジン1ml、次いで、オレイン酸クロリド229mgを塩化メチレン3mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマグラフィーに供し、標記化合物185mg(収納率38%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$  :  $+7.90^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu$  C=O 1704, 1652

### 質量分析 分子式；(

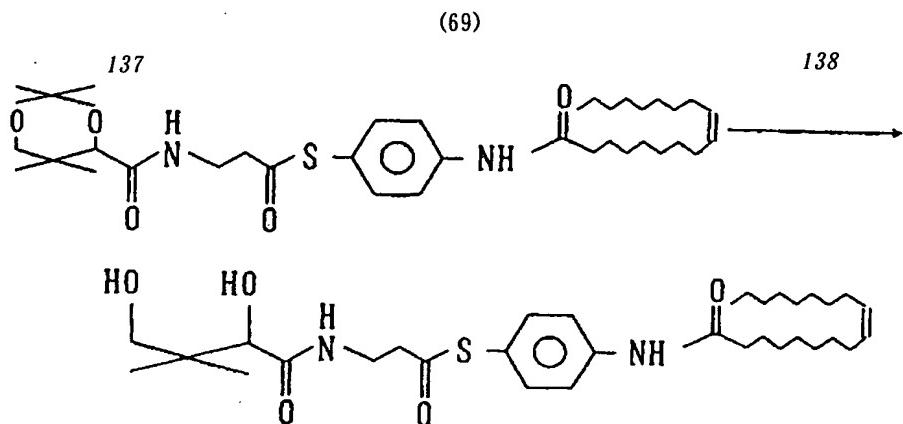
理論值 630.4066

実測値 630.4044

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) : 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
 1.00 (3H, s) , 1.05 (3H, s) , 1.15-1.42  
 (20H, m) , 1.42 (3H, s) , 1.45 (3H, s) ,  
 1.65-1.79 (2H, m) , 1.92-2.08 (4H, m) ,  
 2.37 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.82-3.01 (2H, m) ,  
 3.29 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.47-3.69 (2H, m) ,  
 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.09 (1H, s) , 5.29  
 - 5.42 (2H, m) , 6.85-6.92 (1H, m) , 7.16  
 (1H, s) , 7.34 (2H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 7.60 (2H, d,  
 $J=8\text{Hz}$ )

実施例-24

S - [4 - (オレオイルアミノ) フェニル] 3 - [N -  
 (2,4-ジヒドロ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)  
 アミノ] プロパンチオエート



S-〔4-(オレオイルアミノ)フェニル〕3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロパンチオエート483mgを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後、水20mlを加え塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を水洗し無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物404mg(収率89%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D = +8.80^\circ$  ( $C = 1.0, \text{CHCl}_3$ )

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu$  C=O 1698, 1670

質量分析 分子式： $C_{33}H_{54}N_2O_5S$

理論値 590.3753

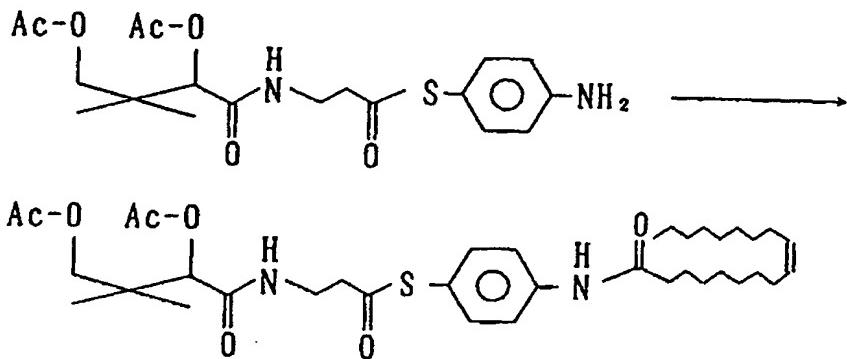
\* 実測値 590.3762

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz)、  
 0.91 (3H, s)、 1.02 (3H, s)、 1.19-1.43  
 (20H, m)、 1.67-1.79 (2H, m)、 1.87-  
 2.17 (6H, m)、 2.36 (2H, t, J=7Hz)、 2.92  
 (2H, t, J=6Hz)、 3.48 (1H, d, J=12Hz)、  
 3.53 (1H, d, J=12Hz)、 3.56-3.65 (2H, m)、  
 4.01 (1H, s)、 5.28-5.42 (2H, m)、 7.12  
 (1H, t, J=6Hz)、 7.26 (1H, brs)、 7.34 (2H,  
 d, J=8Hz)、 7.59 (2H, d, J=8Hz)

実施例-25

S - [4 - (オレオイルアミノ) フェニル] 3 - [N - (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンチオエート

\* ル) アミノ] プロパンチオエート



S-[4-アミノフェニル]3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンチオエート276mgを塩化メチレン20mlに溶かし、冰冷攪拌下にピリジン1ml、次いで、オレイン酸クロリド196mgを塩化メチレン3mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物304mg(収率69%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$  :  $+21.3^\circ$  ( $C = 1.0, \text{CHCl}_3$ )

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu \text{ C=O}$  1750, 1670

質量分析 分子式： $C_{37}H_{58}N_2O_7S$

理論值 674.3964

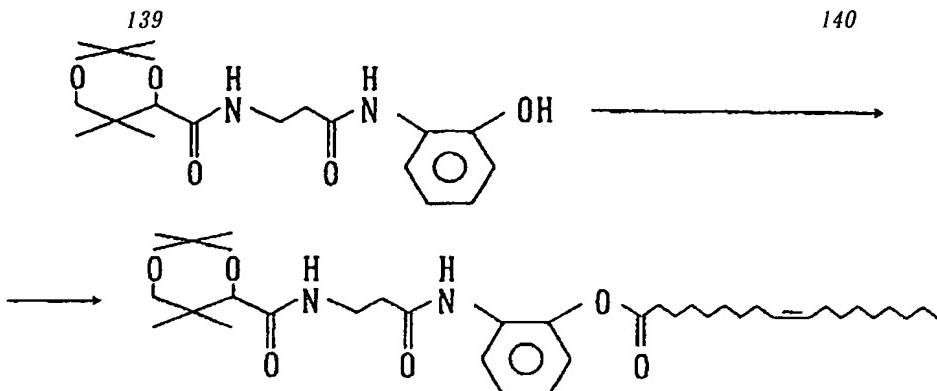
実測値 674.3976

<sup>1</sup>H NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>): 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.00 (3H, s), 1.06 (3H, s), 1.21-1.33 (20H, m), 1.62-1.77 (2H, m), 1.94-2.08 (4H, m), 2.06 (3H, s), 2.10 (3H, s), 2.37 (2H, t, J=7Hz), 2.89 (2H, t, J=6Hz), 3.44-3.68 (2H, m), 3.82 (1H, d, J=11Hz), 4.03 (1H, d, J=11Hz), 4.97 (1H, s), 5.29-5.41 (2H, m), 6.47 (1H, t, J=6Hz), 7.19-7.32 (2H, m), 7.17 (1H, s), 7.35 (2H, d, J=8Hz), 7.61 (2H, d, J=8Hz)

実施例-26

N- [2-(オレオイルオキシ) フェニル] - 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド

(70)



N-(2-ヒドロキシフェニル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド350mgとオレイン酸282mgとジシクロヘキシリカルボジイミド227mg及び4-ジメチルアミノピリジン122mgとをトルエン15mlに溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後生じた結晶を濾過して除き、ろ液を濃縮し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物411mg（収率67%）を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]$  D ; +32.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; νC=O 1768, 1668

質量分析 分子式 ; C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

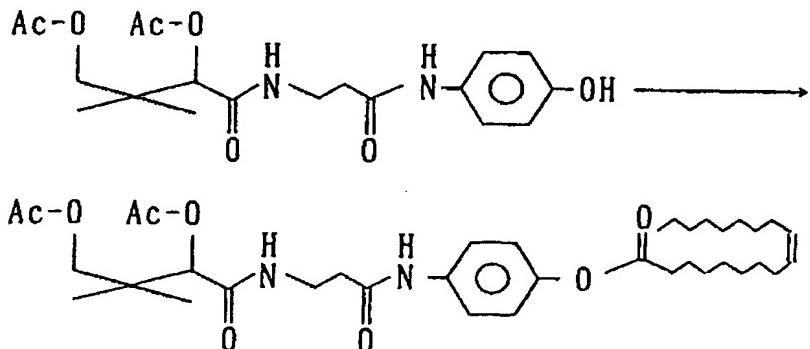
理論値 614.4294

\* 実測値 614.4294

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.96 (3H, s) , 1.03 (3H, s) , 1.23-1.45 (20H, m) , 1.40 (3H, s) , 1.45 (3H, s) , 1.71-1.83 (2H, m) , 1.92-2.08 (4H, m) , 2.58-2.67 (4H, m) , 3.27 (2H, d, J=12Hz) , 3.56-3.64 (2H, m) , 3.67 (1H, d, J=12Hz) , 4.07 (1H, s) , 5.30-5.42 (2H, m) , 7.03-7.17 (3H, m) , 7.19-7.29 (1H, m) , 7.49 (1H, brs) , 8.18 (1H, s, J=8Hz)

実施例-27

N-[4-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド



N-(4-ヒドロキシフェニル)-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド394mgを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷攪拌下にピリジン1ml、次いで、オレイン酸クロリド301mgを塩化メチレン3mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物530mg（収率81%）を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]$  D ; +14.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; νC=O 1746, 1666

質量分析 分子式 ; C<sub>37</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>8</sub>

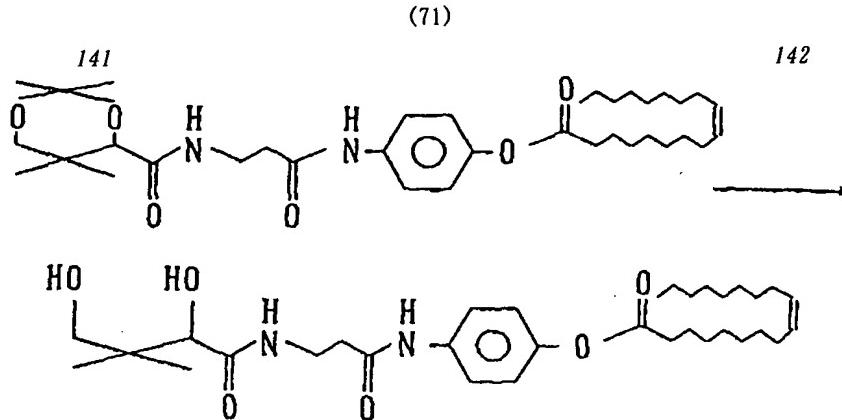
理論値 658.4193

実測値 658.4184

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 1.02 (3H, s) , 1.05 (3H, s) , 1.22-1.42 (20H, m) , 1.68-1.79 (2H, m) , 1.94-2.09 (4H, m) , 2.05 (3H, s) , 2.07 (3H, s) , 2.51-2.59 (4H, m) , 3.54-3.71 (2H, m) , 3.84 (1H, d, J=12Hz) , 4.02 (1H, d, J=12Hz) , 4.88 (1H, s) , 5.28-5.42 (2H, m) , 6.72 (1H, t, J=6Hz) , 7.34 (2H, d, J=8Hz) , 7.54 (2H, d, J=8Hz) , 7.71 (1H, brs)

実施例-28

N-[4-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド



N-[4-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド1.0gを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後、水20mlを加え塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し標記化合物830mg(収率89%)を得た。

性状：油状

旋光度  $[\alpha]_D = +21.0^\circ$  ( $C = 1.0, \text{CHCl}_3$ )

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu \approx 1760, 1660$

質量分析 分子式： $C_{33}H_{54}N_2O_6$

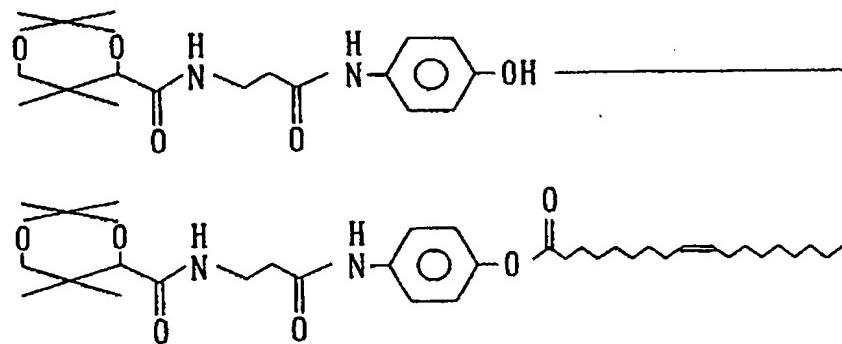
理論值 574.3981

実測値 574.3977

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
 0.90 (3H, s) , 0.98 (3H, s) , 1.19-1.46  
 (20H, m) , 1.41 (3H, s) , 1.68-1.79 (2H,  
 m) , 1.93-2.09 (4H, m) , 2.55 (2H, t, J=7Hz) , 2.  
 59 (2H, t, J=6Hz) , 2.72 (2H, brs) ,  
 3.55-3.68 (2H, m) , 3.48 (2H, s) , 3.98  
 (1H, s) , 5.29-5.42 (2H, m) , 7.45-7.53  
 (1H, m) , 7.00 (2H, d, J=8Hz) , 7.52 (2H, d,  
 8Hz) , 8.35 (1H, s)

## 20 実施例-29

N- [4 - (オレオイルオキシ) フェニル] - 3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド



N-（4-ヒドロキシフェニル）-3-[N-（2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル）アミノ]プロパンアミド1.44gを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷攪拌下にビリジン5ml、次いで、オレイン酸クロリド1.20gを塩化メチレン10mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物1.93g（収率79%）を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$  ;  $+32.6^\circ$  ( $C = 1.0, \text{CHCl}_3$ )

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu$  C=O 1764, 1668

質量分析 分子式： $C_{36}H_{58}N_2O_6$

理論值 614.4294

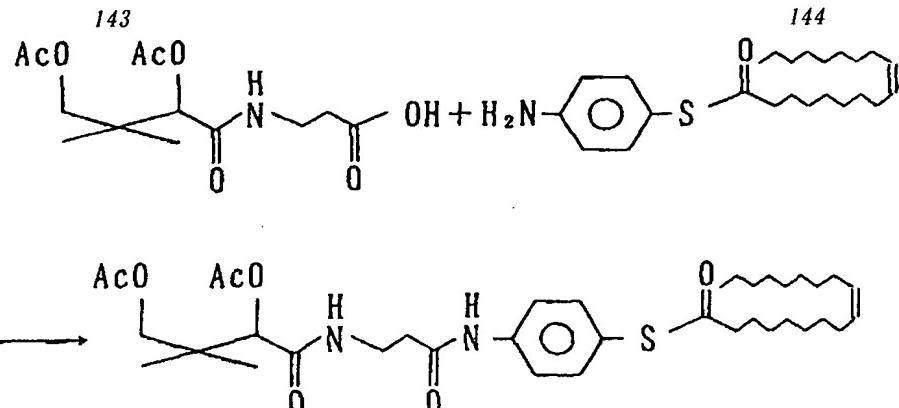
実測値 614.4319

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
 0.96 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.23-1.45  
 (20H, m) , 1.41 (3H, s) , 1.46 (3H, s) ,  
 1.66-1.70 (2H, m) , 1.93-2.09 (4H, m) ,  
 2.54 (2H, t, J=7Hz) , 2.66 (2H, t, J=6Hz) ,  
 3.27 (1H, d, J=12Hz) , 3.52-3.77 (2H, m) ,  
 3.68 (1H, d, J=12Hz) , 4.10 (1H, s) ,  
 5.29-5.42 (2H, m) , 7.01-7.10 (1H, m) ,  
 7.01 (2H, d, J=8Hz) , 7.57 (2H, d, J=8Hz)  
 8.11 (1H, s)

实施例-30

N- [4-(オレオイルチオ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

(72)



S-p-アミノフェニルチオオレエート779mgと3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオン酸606mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド442mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物780mg(収率58%)を得た。

性状；油状

施光度  $[\alpha]$  D ; +14.5° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01748, 1672$

質量分析 分子式 ; C<sub>37</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>7</sub>S

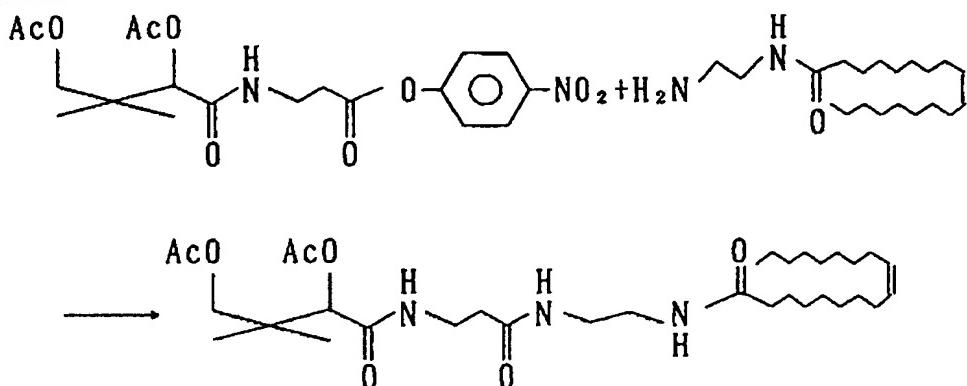
理論値 674.3964

実測値 674.3991

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz) , 1.03 (3H, s) , 1.06 (3H, s) , 1.22-1.41 (20H, m) , 1.64-1.75 (2H, m) , 1.96-2.08 (4H, m) , 2.05 (3H, s) , 2.08 (3H, s) , 2.58 (2H, t, J=6Hz) , 2.64 (2H, t, J=7Hz) , 3.55 - 3.70 (2H, m) , 3.85 (1H, d, J=11Hz) , 4.02 (1H, d, J=11Hz) , 4.87 (1H, s) , 5.28 - 5.43 (2H, m) , 6.69 (1H, t, J=6Hz) , 7.34 (1H, d, J=8Hz) , 7.60 (2H, d, J=8Hz) , 7.81 (1H, brs)

#### 実施例-31

N-(2-N-オレオイルアミノエチル)-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド



N-(2-アミノエチル)オレオイルアミド1.07gと4-ニトロフェニル3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート1.40gとをテトラハイドロフラン40mlに溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後、溶媒を減圧下に留去し、残留物を酢酸エチルに溶かし、炭酸カリウム水溶液、次いで、水で洗浄し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物4.45g(収率75%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C-H}}=2980, \nu_{\text{C}}=01740, 1650$

質量分析 分子式 ; C<sub>33</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 609.4352

実測値 609.4342

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 1.05 (3H, s) , 1.09 (3H, s) , 1.10-1.40 (18H, m) , 1.54-2.42 (12H, m) , 2.07 (3H, s) , 2.16 (3H, s) , 3.20-3.60 (6H, m) , 3.86 (1H, d, J=11Hz) , 4.05 (1H, d, J=11Hz) , 4.86 (1H, s) , 5.30-5.40 (2H, m) , 6.14-6.22 (1H, brs) , 6.52-6.60 (1H, brs) , 7.04-7.12 (1H, brs)

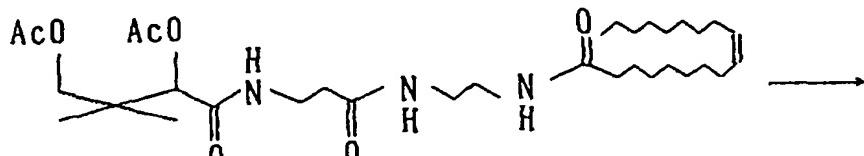
#### 実施例-32

N-(2-N-オレオイルアミノエチル)-3-[N-

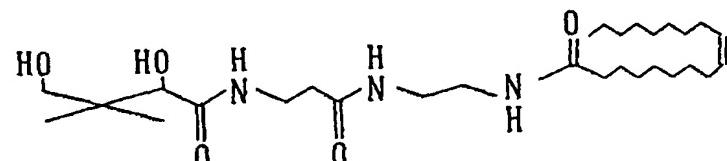
(73)

145

(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチルアミノ)プロパンアミド



146



N-(2-N-オレオイルアミノエチル)-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド200mgをメタノール10mlに溶かし、室温攪拌下に1規定カセイソーダ水溶液0.5mlを加え、2時間攪拌した。反応終了後、減圧下で溶媒を留去し、酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物150mg(収率86%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{OH}} 3324$ ,  $\nu_{\text{C=O}} 1650$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{29}\text{H}_{53}\text{N}_3\text{O}_4$ 

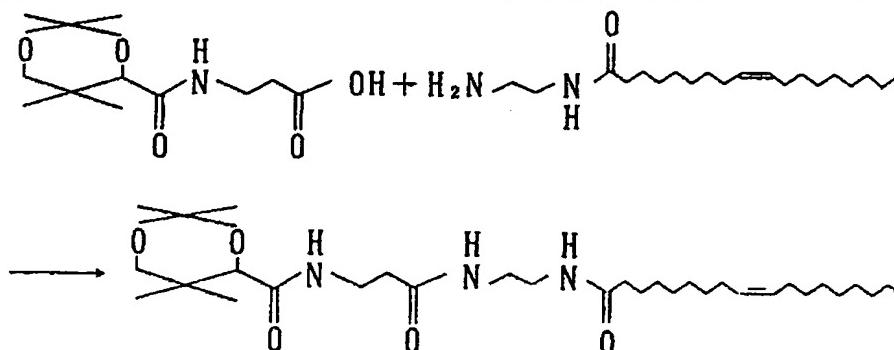
理論値 507.4011

※ 実測値 507.4044

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
0.94 (3H, s) , 1.00 (3H, s) , 1.16-1.40  
(17H, m) , 1.50-1.64 (2H, m) , 1.92-  
2.08 (4H, m) , 2.19 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.30-  
2.80 (6H, m) , 3.20-3.54 (6H, m) , 3.62-  
3.74 (1H, m) , 4.02 (1H, s) , 5.39-5.44  
(2H, m) , 6.40-6.50 (1H, m) , 6.96-7.04  
(1H, m) , 7.45-7.53 (1H, m)

実施例-33

N-(2-N-オレオイルアミノエチル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド



N-(2-アミノエチル)オレオイルアミド3.38gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gと塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.58g(収率81%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C=O}} 1650$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{32}\text{H}_{59}\text{N}_3\text{O}_5$ 

理論値 565.4455

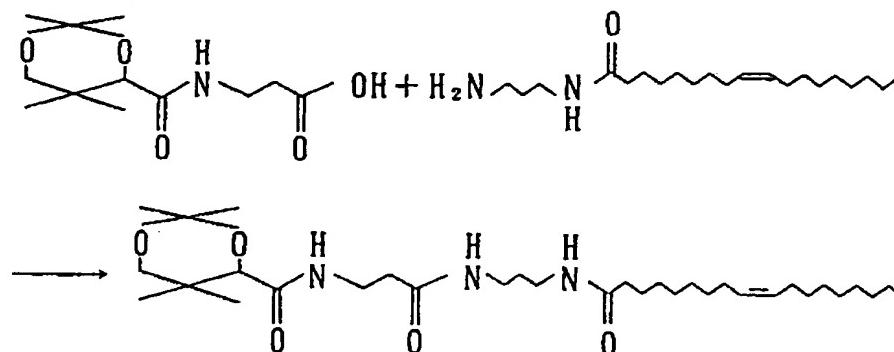
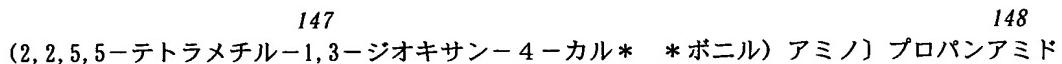
実測値 565.4454

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.23-1.40  
(14H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (1H, s) ,  
1.52-1.86 (6H, m) , 1.92-2.10 (4H, m) ,  
2.18 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.46 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) ,  
3.29 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.38 (3H, brs) ,  
3.44-3.62 (4H, m) , 3.67 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) ,  
4.08 (1H, s) , 5.30-5.42 (2H, m) , 6.20-  
6.30 (1H, brs) , 6.65-6.73 (1H, brs) ,  
6.99-7.08 (1H, brs)

実施例-34

N-(3-オレオイルアミノプロピル)-3-[N-

(74)



N-(3-アミノプロピル)オレオイルアミド3.39gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gと塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.7g(収率47%)を得た。

性状：油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01660$

質量分析 分子式;  $C_{33}H_{61}N_3O_5$

理論値 579.4611

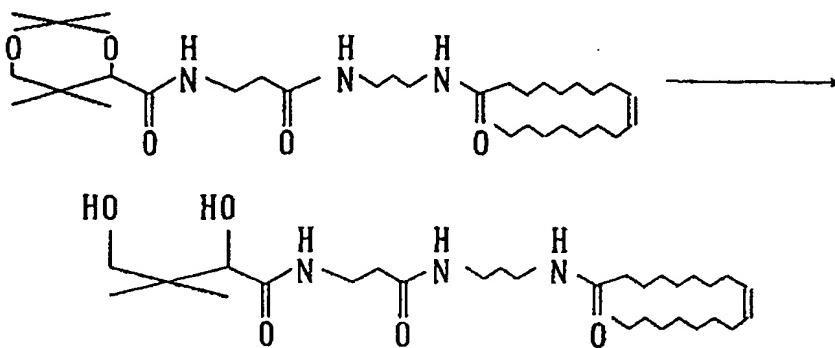
実測値 579.4630

※NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.10-1.40  
(20H, m) , 1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) ,  
1.54-1.90 (5H, m) , 1.90-2.10 (3H, m) ,  
2.20 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.47 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) ,  
3.20-3.36 (5H, m) , 3.48-3.66 (2H, m) ,  
3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.08 (1H, s) , 5.30  
- 5.40 (2H, m) , 6.15-6.25 (1H, m) , 6.58  
- 6.66 (1H, m) , 7.02-7.10 (1H, m)

#### 実施例-35

N-(3-オレオイルアミノプロピル)-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

※



N-(3-オレオイルアミノプロピル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド0.58gを酢酸20mlと水10mlの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後減圧で溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.48g(収率89%)を得た。

性状：油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01650$

質量分析 分子式;  $C_{30}H_{57}N_3O_5$

理論値 539.4297

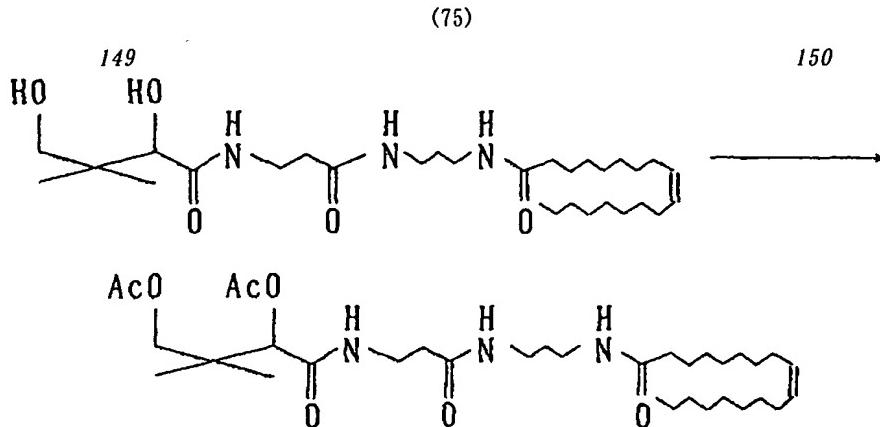
実測値 539.4291

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,

0.90 (3H, s) , 1.01 (3H, s) , 1.20-1.40  
(20H, m) , 1.55-1.68 (4H, m) , 1.92-  
2.08 (4H, m) , 2.19 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 2.36-  
2.54 (2H, m) , 3.16-3.40 (6H, m) , 3.48  
(2H, s) , 3.42-3.56 (1H, m) , 3.62-3.76  
(1H, m) , 4.00 (1H, s) , 5.28-5.42 (2H, m) ,  
6.18-6.24 (1H, m) , 6.85-6.94 (1H, m) ,  
7.42-7.52 (1H, m)

#### 実施例-36

N-(3-オレオイルアミノプロピル)-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド



N-（3-オレオイルアミノプロビル）-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド0.54gをピリジン5mlに溶かし無水酢酸10mlを加え一夜攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.62g（収率99%）を得た。

性状：油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu \approx 1738, 1658$

質量分析 分子式： $C_{34}H_{61}N_{30}I$

理論值 623,4508

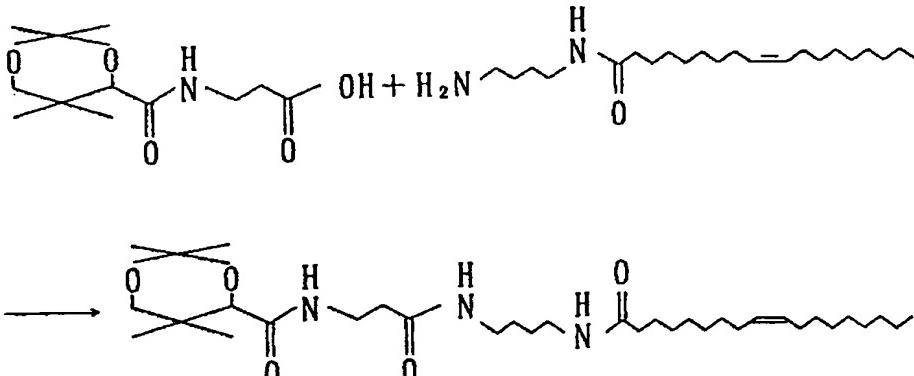
実測値 623.4499

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) : 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) .

\* 1.04 (3H, s) , 1.08 (3H, s) , 1.16-1.50  
 (23H, m) , 1.56-1.72 (2H, m) , 1.90-  
 2.06 (2H, m) , 2.07 (3H, s) , 2.15 (3H, s) ,  
 2.19 (2H, t,  $J=7$ Hz) , 2.46 (2H, t,  $J=6$ Hz) ,  
 2.32-2.48 (2H, m) , 3.16-3.40 (5H, m) ,  
 3.48-3.62 (2H, m) , 3.86 (1H, d,  $J=11$ Hz) ,  
 4.03 (1H, s) , 4.90 (1H, s) , 5.28-5.40  
 (2H, m) , 5.95-6.06 (1H, m) , 6.60-6.70  
 (1H, m) , 7.18-7.28 (1H, m)

実施例-37

N- (4-オレオイルアミノブチル) - 3 - [N- (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド



N-(4-アミノブチル)オレオイルアミド3.77gと  
 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-  
 -4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gと塩酸  
 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.66g(収率45%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu \approx 1648$

質量分析 分子式： $C_{34}H_{63}N_{30}S$

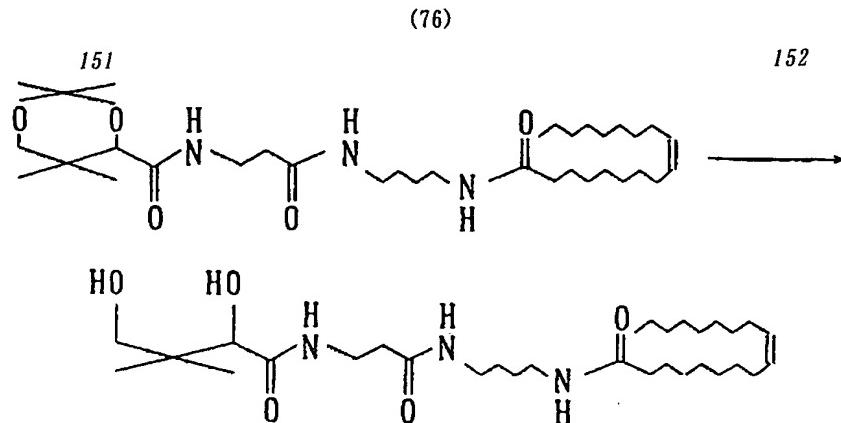
理論值 593.4768

実測値 593.4797

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz)、  
 0.97 (3H, s)、1.04 (3H, s)、1.20-1.40  
 (18H, m)、1.43 (3H, s)、1.46 (3H, s)、  
 1.50-1.70 (6H, m)、1.86-2.10 (6H, m)、  
 2.16 (2H, t, J=8Hz)、2.45 (2H, t, J=6Hz)、  
 3.20-3.32 (5H, m)、3.42-3.66 (2H, m)、  
 3.69 (1H, d, J=12Hz)、4.08 (1H, s)、5.26  
 -5.42 (2H, m)、5.78-5.86 (1H, m)、6.35  
 -6.45 (1H, m)、7.02-7.12 (1H, m)

実施例-38

N-（4-オレオイルアミノブチル）-3-[N-（2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル）アミノ]プロパンアミド



N-(4-オレオイルアミノブチル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド1.19gを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後減圧で溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.43g(収率39%)を得た。

性状：油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) :  $\nu \approx 1650$

質量分析 分子式： $C_{31}H_{59}N_{30}S$

理論值 553.445

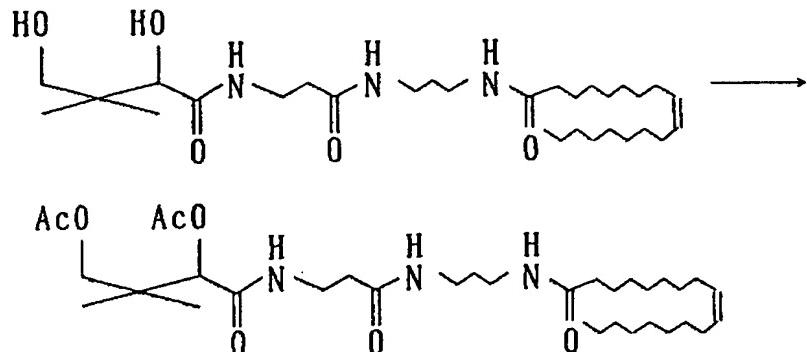
寒測值 553.4474

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz)、  
 0.95 (3H, s)、 0.99 (3H, s)、 1.18-1.40  
 (17H, m)、 1.40-1.66 (6H, m)、 1.92-  
 2.10 (4H, m)、 2.18 (2H, t, J=6Hz)、 2.40-  
 2.50 (2H, m)、 2.70-3.32 (6H, m)、 3.32-  
 3.72 (6H, m)、 4.00 (1H, s)、 5.30-5.42  
 (2H, m)、 6.04-6.10 (1H, m)、 6.60-6.70  
 (1H, m)、 7.42-7.52 (1H, m)

20 寒施例-39

N-4-(オレオイルアミノブチル)-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)

#### \* アミノ】プロパンアミド



N-(4-オレオイルアミノブチル)-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド0.55gをピリジン5mlに溶かし、無水酢酸10mlを加え一夜攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.52g(収率82%)を得た。

性状：油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu \approx 1730, 1650$

質量分析 分子式： $C_{35}H_{63}N_3O_7$

理論值 637.4566

実測値 637.4584

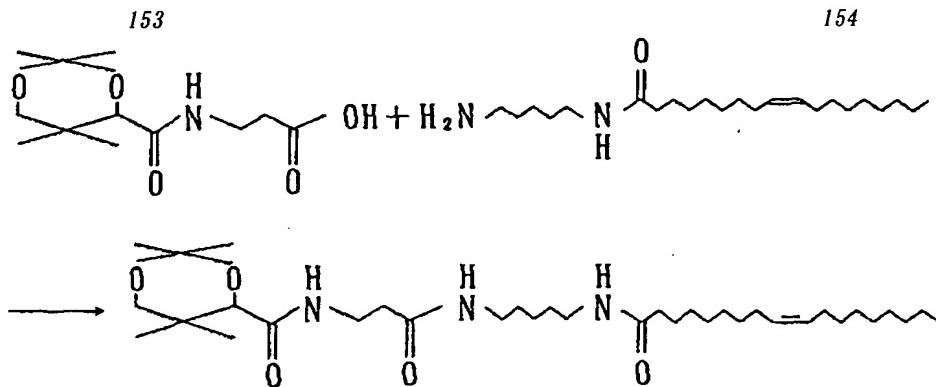
NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) : 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) .

1.03 (3H, s) , 1.07 (3H, s) , 1.20-1.40  
 (18H, m) , 1.50-1.70 (6H, m) , 1.70-  
 2.10 (6H, m) , 2.07 (3H, s) , 2.16 (3H, s) ,  
 2.16 (2H, t, J=7Hz) , 2.38 (2H, t, J=6Hz) ,  
 3.20-3.30 (4H, m) , 3.42-3.62 (2H, m) ,  
 3.85 (1H, d, J=11Hz) , 4.20 (1H, d, J=11Hz) ,  
 4.93 (1H, s) , 5.30-5.42 (2H, m) , 5.76-  
 5.86 (1H, m) , 6.22-6.30 (1H, m) , 7.00-  
 7.08 (1H, m)

实施例-40

N-（5-オレオイルアミノペンチル）-3-[N-  
(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
ボニル)アミノ]プロパンアミド

(77)



N-(5-アミノペンチル)オレオイルアミド3.66gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gと塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.64g(収率60%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01660$ 質量分析 分子式; C<sub>35</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

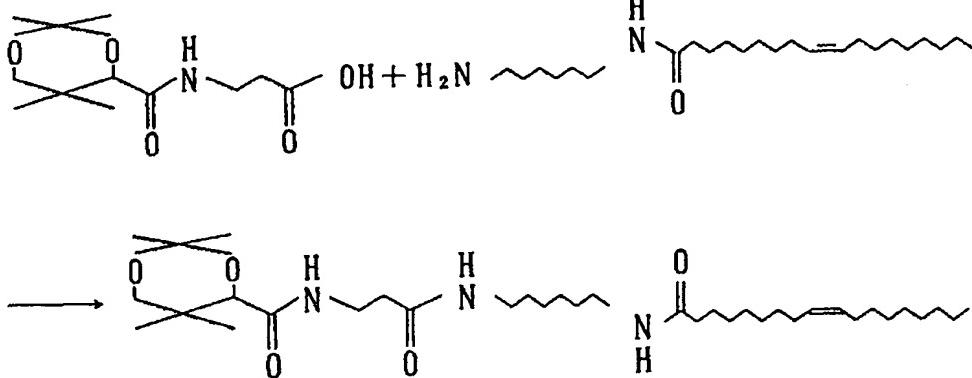
理論値 607.4923

実測値 607.4906

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.74 (30H, m) , 1.46 (3H, s) , 1.48 (3H, s) , 1.90-2.10 (4H, m) , 2.16 (3H, t, J=7Hz) , 2.44 (2H, t, J=7Hz) , 3.24 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz) , 3.29 (1H, d, J=12Hz) , 3.44-3.66 (2H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) , 4.07 (1H, s) , 5.32-5.44 (2H, m) , 5.54-5.62 (1H, m) , 6.05-6.12 (1H, m) , 6.96-7.08 (1H, m)

## 実施例-41

N-(6-オレオイルアミノヘキシル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド



N-(6-アミノヘキシル)オレオイルアミド3.81gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gと塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.92g(収率47%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01664, 1644$ 質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>67</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 621.5080

実測値 621.5057

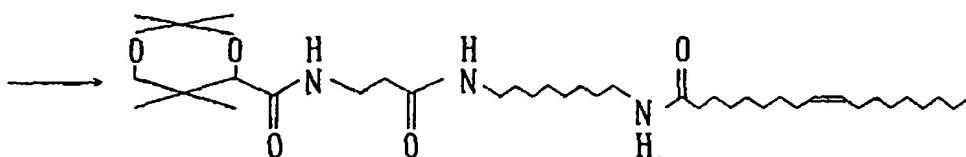
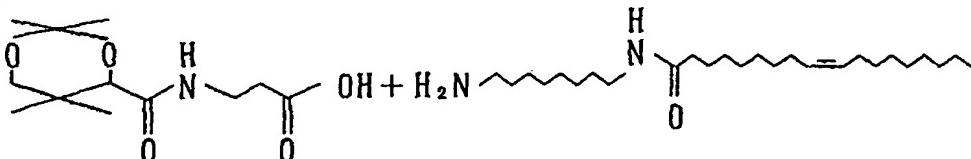
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.18-1.76 (32H, m) , 1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 1.92-2.10 (4H, m) , 2.15 (2H, t, J=7Hz) , 2.44 (2H, t, J=7Hz) , 3.23 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz) , 3.29 (1H, d, J=12Hz) , 2.44-3.66 (4H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) , 4.07 (1H, s) , 5.30-5.42 (2H, m) , 5.48-5.58 (1H, m) , 5.96-6.06 (1H, m) , 7.00-7.06 (1H, m)

## 実施例-42

N-(8-オレオイルアミノオクチル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]オクタノン

(78)

155  
ボニル) アミノ] プロパンアミド



N - (8-アミノオクチル) オレオイルアミド 4.08g と 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸 2.59g と 塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド 1.91g を 塩化メチレン 50ml に 溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物 1.36g (収率 21%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01664, 1644$

質量分析 分子式;  $\text{C}_{38}\text{H}_{71}\text{N}_3\text{O}_5$

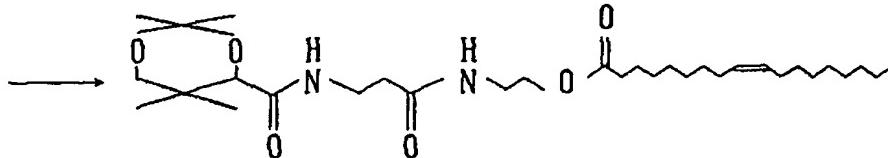
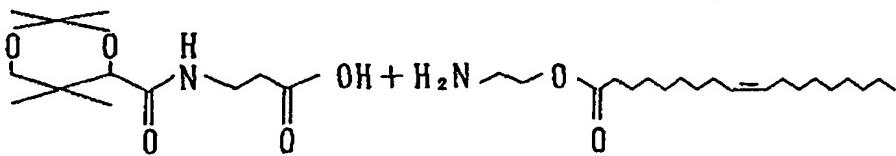
理論値 649.5392

実測値 649.53886

\* NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.40 (2H, m) , 1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 1.56-1.72 (4H, m) , 1.92-2.10 (4H, m) , 2.15 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.43 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 3.18-3.26 (5H, m) , 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.44-3.66 (4H, m) , 3.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.07 (1H, s) , 5.30-5.40 (2H, m) , 5.40-5.48 (1H, m) , 5.86-5.94 (1H, m) , 6.98-7.06 (1H, m)

実施例-43

N - (2-オレオイルオキシエチル) - 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド



2-アミノエチル オレイネート 3.26g と 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸 2.59g と 塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド 1.91g を 塩化メチレン 50ml に 溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物 1.75g (収率 31%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01742, 1660$

質量分析 分子式;  $\text{C}_{32}\text{H}_{58}\text{N}_2\text{O}_6$

理論値 566.4294

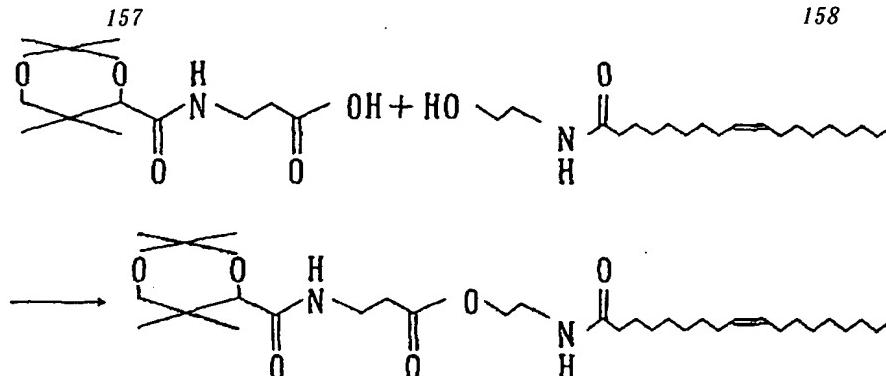
実測値 566.4304

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.16-1.40 (2H, m) , 1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 1.52-1.70 (4H, m) , 1.70-1.90 (2H, m) , 1.96-2.08 (2H, m) , 2.32 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.46 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 3.29 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.42-3.66 (4H, m) , 3.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.07 (1H, s) , 4.15 (2H, t,  $J=12\text{Hz}$ ) , 5.32-5.40 (2H, m) , 6.08-6.18 (1H, m) , 6.98-7.08 (1H, m)

実施例-44

2 - (N-オレオイルアミノ) エチル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

(79)



N-(2-ヒドロキシエチル)オレオイルアミド 0.97gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸0.78gとジシクロヘキシリカルボジイミド0.61g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン0.36gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.50g(収率90%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=1742, 1658$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{32}\text{H}_{58}\text{N}_2\text{O}_6$ 

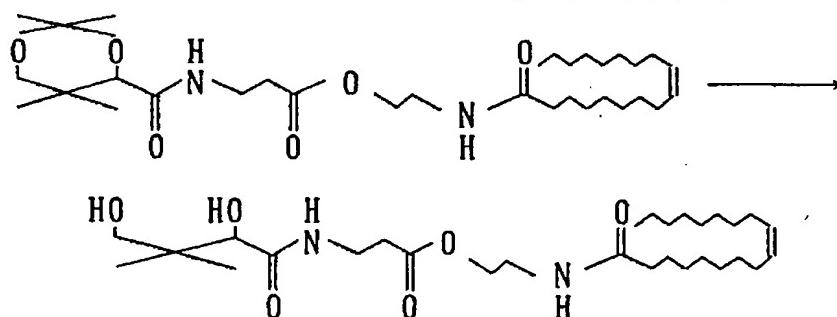
理論値 566.4254

\* 実測値 566.4274

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ )、  
0.98 (3H, s)、1.03 (3H, s)、1.22-1.38  
(18H, m)、1.43 (3H, s)、1.47 (3H, s)、  
1.50-1.72 (5H, m)、1.92-2.08 (4H, m)、  
2.21 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ )、2.56 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ )、  
3.29 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ )、3.42-3.70 (4H, m)、  
3.66 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ )、4.08 (1H, s)、4.18  
(1H, s)、5.28-5.40 (2H, m)、6.27-6.38  
(1H, brs)、6.88-6.96 (1H, brs)

## 実施例-45

2-(N-オレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート



2-(N-オレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート880mgを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後減圧で溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物740mg(収率91%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{OH}}=3324, \nu_{\text{C}}=1740, 1650$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{29}\text{H}_{54}\text{N}_2\text{O}_6$ 

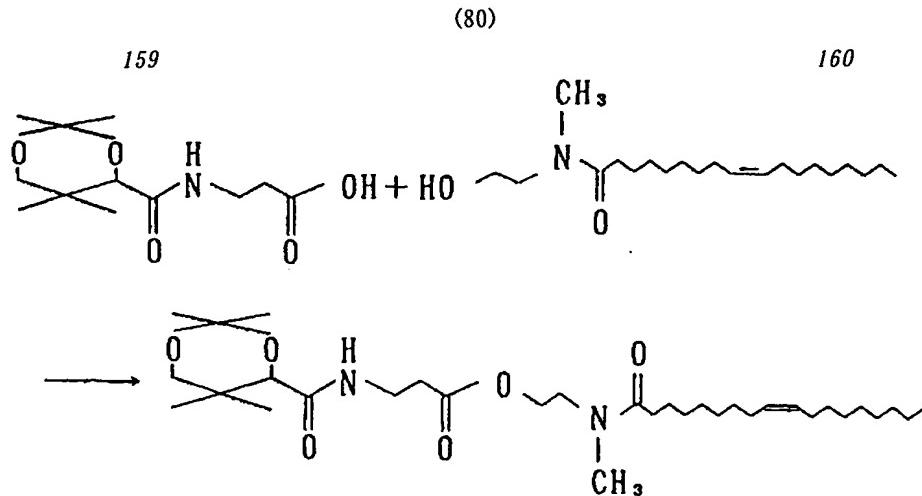
理論値 526.3952

実測値 526.3961

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ )、  
0.94 (3H, s)、1.04 (3H, s)、1.20-1.40  
(20H, m)、1.52-1.68 (2H, m)、1.90-  
2.10 (3H, m)、2.20 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ )、2.49-  
2.58 (2H, m)、2.80-3.30 (3H, m)、3.38-  
3.76 (6H, m)、4.02 (1H, s)、4.05-5.42 (2H,  
m)、6.20-6.30 (1H, brs)、7.30-7.40  
(1H, brs)

## 実施例-46

2-(N-メチル-N-オレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート



N-メチル-N-(2-ヒドロキシエチル)オレオイルアミド3.40gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオニ酸2.59gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.42g(収率59%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu$  C=O 1740, 1658  
質量分析 分子式;  $\text{C}_{33}\text{H}_{60}\text{N}_2\text{O}_6$

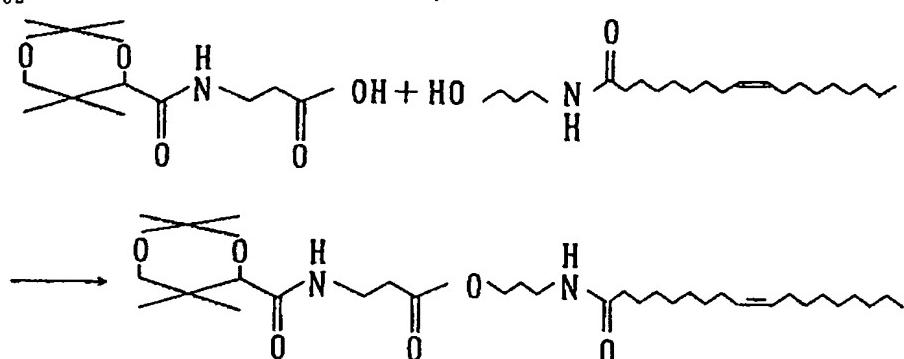
理論值 580.4452

\* 実測値 580.4478

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>): 0.88 (3H, t, J=7Hz),  
 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.22-1.42  
 (19H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.55-1.70 (3H, m), 1.90-2.10 (4H, m),  
 2.30 (2H, tt, J=7Hz, 7Hz), 2.52-2.60 (2H,  
 m), 3.05 (3H, s), 3.29 (1H, d, J=12Hz),  
 3.42-3.67 (4H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz),  
 4.08 (1H, s), 4.24 (2H, t, J=7Hz), 5.30-  
 5.42 (2H, m), 6.98-7.08 (1H, m)

寒施例-47

3-(N-オレオイルアミノ) プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート



N-（3-ヒドロキシプロピル）オレオイルアミド3.40gと3-[N-（2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル）アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.52g（収率78%）を得た。

性状；油状

40 IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) :  $\nu \approx 1740, 1654$

質量分析 分子式： $C_{33}H_{60}N_2O_6$

理論值 580.4450

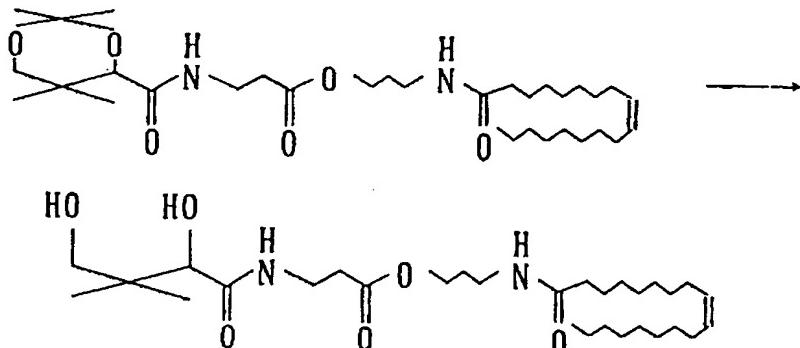
実測値 580.4449

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
 0.98 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.10-1.50  
 (21H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.46 (3H, s) ,  
 1.52-1.86 (2H, m) , 1.84 (2H, tt, J=6Hz,  
 7Hz) , 1.90-2.10 (3H, m) , 2.17 (2H, t,  
 J=7Hz) , 2.56 (2H, t, J=6Hz) , 3.28 (1H, d,  
 J=12Hz) , 3.33 (2H, dd, J=6Hz, 7Hz) ,

(81)

161

3.35-3.60 (2H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) ,  
4.08 (1H, s) , 4.15 (2H, t, J=7Hz) , 5.28-  
5.42 (2H, m) , 5.92-60.2 (1H, brs) , 6.90  
- 7.00 (1H, brs)



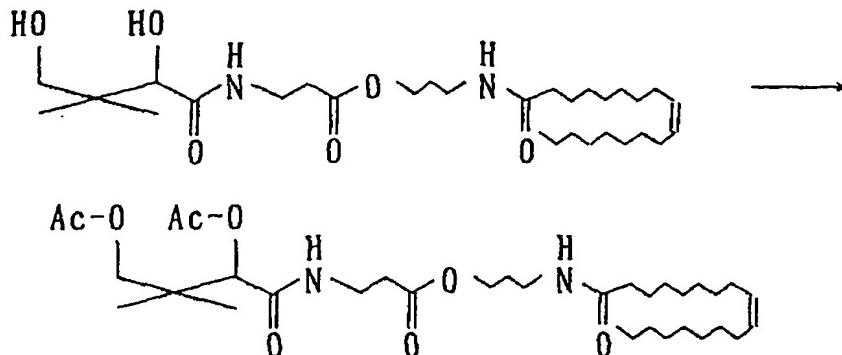
3-N-オレオイルアミノプロピル 3-[N-(2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート 0.58gを酢酸20mlと水10mlの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後減圧で溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.49g(収率90%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=1740, 1652$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{30}\text{H}_{56}\text{N}_2\text{O}_6$ 

理論値 540.4145

実測値 540.4138

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz),

3-N-オレオイルアミノプロピル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート 540mgをピリジン5mlに溶かし、無水酢酸10mlを加え一夜攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物500mg(収率80%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=1740, 1650$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{34}\text{H}_{60}\text{N}_2\text{O}_8$ 

理論値 624.4348

40 実測値 624.4323

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz),  
1.04 (3H, s) , 1.07 (3H, s) , 1.15-1.40  
(2H, m) , 1.55-1.72 (2H, m) , 1.84 (2H,  
tt, J=6Hz, 6Hz) , 1.92-2.10 (3H, m) ,  
2.07 (3H, s) , 2.15 (3H, s) , 2.16 (2H,  
t, J=7Hz) , 2.54 (2H, t, J=6Hz) , 3.20-  
3.68 (4H, m) , 3.83 (1H, d, J=11Hz) ,  
4.09 (1H, d, J=11Hz) , 4.12 (2H, d, J=6Hz) ,  
4.93 (1H, s) , 5.30-5.38 (2H, m) , 5.92-  
6.02 (1H, m) , 6.70-6.80 (1H, m)

162

\* 実施例-48

3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート

(82)

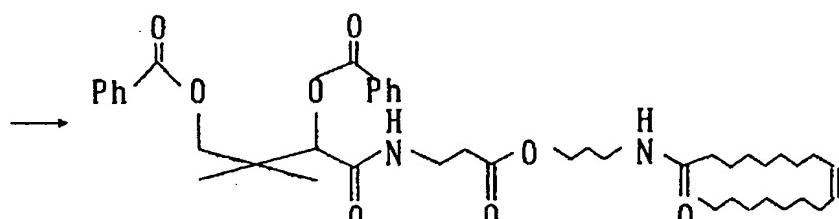
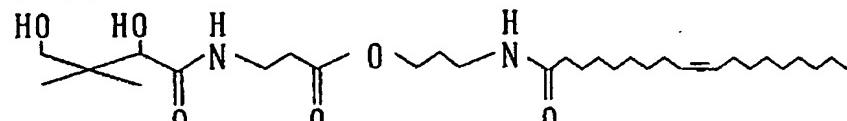
163

## 実施例-50

3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-

164

\*(2,4-ジベンゾイルオキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート



3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート270mgをピリジン5mlに溶かし、塩化ベンゾイル281mgを加え一夜攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物260mg(収率69%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01722, 1650$ 質量分析 分子式;  $C_{44}H_{64}N_2O_8$ 

理論値 748.4662

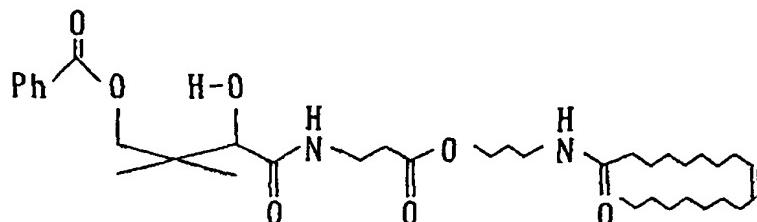
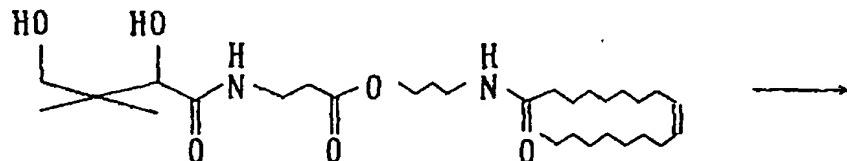
実測値 748.4673

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),

※ 1.20-1.40 (25H, m), 1.52-1.64 (2H, m),  
1.76 (2H, tt,  $J=6\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ), 1.92-2.06 (4H,  
m), 2.11 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 2.51 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ),  
3.18-3.40 (2H, m), 3.40-3.66  
(2H, m), 4.02 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ), 4.28 (1H,  
d,  $J=10\text{Hz}$ ), 4.33 (1H, d,  $J=10\text{Hz}$ ), 5.30  
- 5.40 (2H, m), 5.82-5.92 (1H, m), 6.78  
- 6.86 (1H, m), 7.40-7.50 (4H, m), 7.52  
- 7.64 (2H, m), 8.00-8.10 (4H, m)

## 実施例-51

3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(4-ベンゾイルオキシ-2-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート



3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート540mgをピリジン5mlに溶かし、塩化ベンゾイル140mgを加え一夜攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物318mg(収率51%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01740, 1720, 1660$ 質量分析 分子式;  $C_{37}H_{60}N_2O_6$ 

理論値 628.4449

実測値 628.4423

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),  
1.06 (3H, s), 1.18 (3H, s), 1.16-1.40  
(17H, m), 1.48-1.62 (2H, m), 1.62-  
1.70 (3H, m), 1.81 (2H, tt,  $J=7\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ),  
1.92-2.08 (3H, m), 2.11 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),  
2.42-2.70 (2H, m), 3.18-3.30 (1H, m),  
3.34-3.48 (2H, m), 3.64-3.76 (1H, m),  
4.00-4.05 (2H, m), 4.12 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ),  
4.14-4.24 (1H, m), 4.38 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ),  
4.64-4.68 (1H, brs), 5.28-5.40 (2H, m),  
5.72-5.82 (1H, brs), 7.30-7.38 (1H, m),  
7.44 (2H, dd,  $J=7\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ), 7.56 (1H, dd,

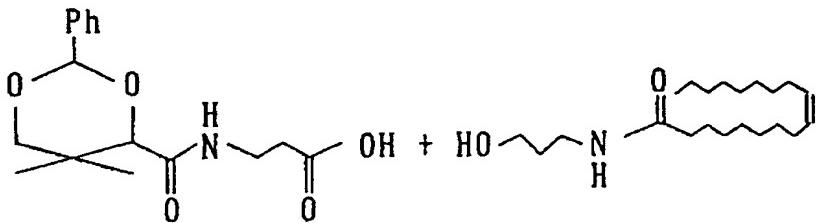
(83)

165

 $J = 7\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ), 8.05 (2H, d,  $J = 7\text{Hz}$ )

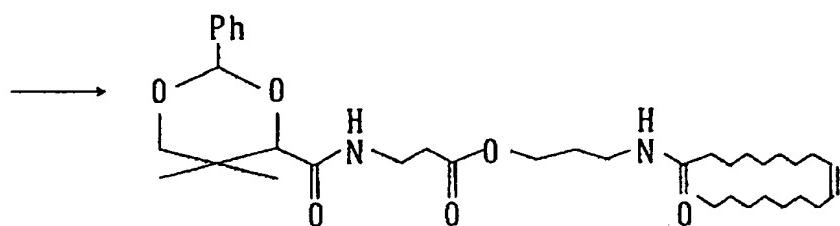
実施例-52

3-N-オレオイルアミノプロピル 3-[N-(2-\*)



166

\*フェニル-5,5-ジメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート



N-(3-ヒドロキシプロピル)オレオイルアミド3.  
40gと3-[N-(2-フェニル-5,5-ジメチル-1,3-  
-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオニ酸  
3.07gとジシクロヘキシカルボジイミド2.06g及び4-  
(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30  
mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿  
物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で  
洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去  
し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供  
し精製し、標記化合物5.34g(収率85%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat);  $\nu = 1738, 1662$ 質量分析 分子式;  $C_{37}H_{60}N_2O_6$ 

理論値 628.4452

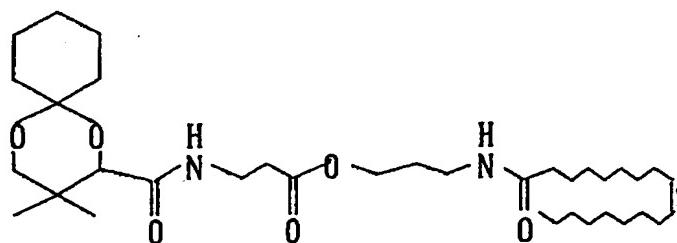
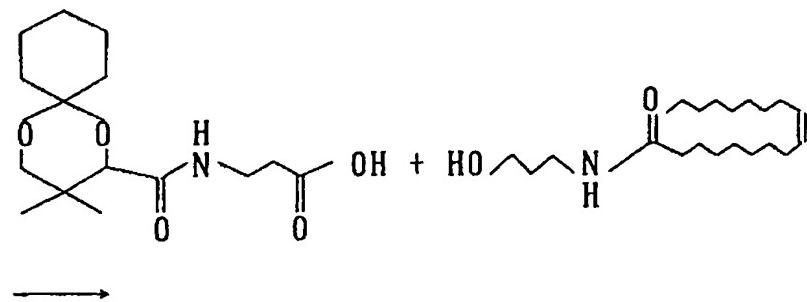
実測値 628.4465

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ); 0.88 (3H, t,  $J = 7\text{Hz}$ ),

1.11 (3H, s), 1.20 (3H, s), 1.22-1.43  
(13H, m), 1.52-1.72 (6H, m), 1.77 (2H,  
tt,  $J = 7\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ), 1.90-2.06 (4H, m),  
2.14 (2H, tt,  $J = 7\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ), 2.38 (2H, t,  $J =$   
 $7\text{Hz}$ ), 2.52 (2H, t,  $J = 7\text{Hz}$ ), 3.26 (1H,  
dt,  $J = 6\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ), 3.46-3.62 (4H, m),  
3.69 (1H, d,  $J = 12\text{Hz}$ ), 4.10 (1H, t,  $J = 7\text{Hz}$ ),  
4.11 (1H, s), 5.30-5.42 (2H, m), 5.52  
(1H, s), 5.82-5.92 (1H, m), 6.90-7.04  
(1H, m), 7.38-7.44 (3H, m), 7.48-7.53  
(2H, m)

実施例-53

3-N-オレオイルアミノプロピル 3-[N-(3,3-  
-ジメチル-1,5-ジオキサン-2-基)ウニデカン-  
3-カルボニル)アミノ]プロピオネート



(84)

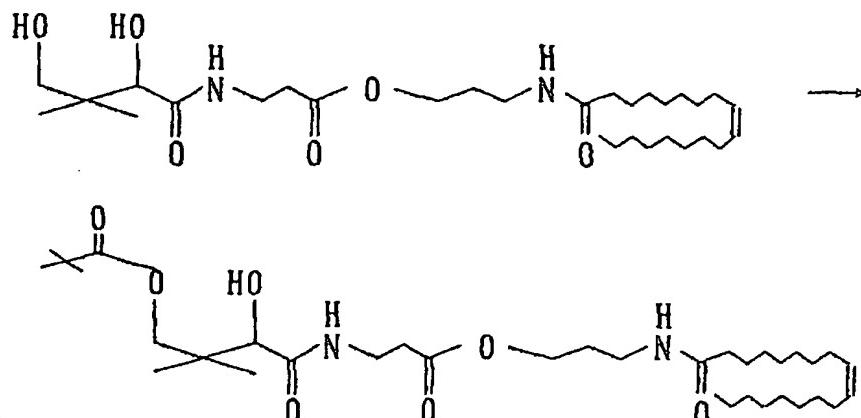
167

N-(3-ヒドロキシプロピル)オレオイルアミド3.40gと3-[N-(3,3-ジメチル-1,5-ジオキサスピロ[5,5]ウンデカン-3-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.99gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物5.46g(収率88%)を得た。

性状：油状

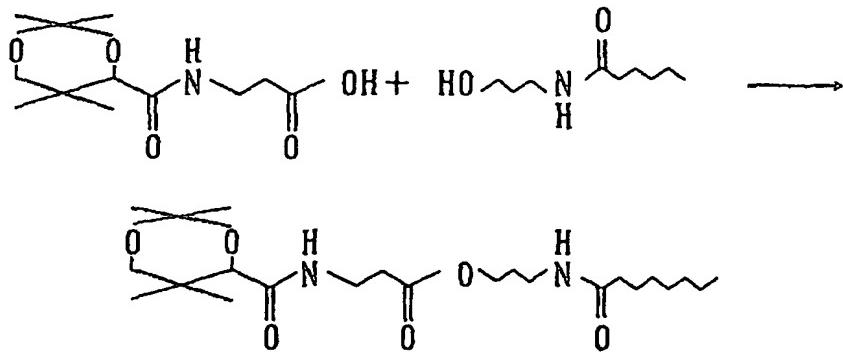
IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01740, 1652$ 質量分析 分子式 :  $\text{C}_{36}\text{H}_{64}\text{N}_2\text{O}_6$ 

理論値 620.4763



3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート540mgをピリジン5mlに溶かし、塩化ビバロイル220mgを加え一夜攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物139mg(収率2.2%)を得た。

性状：油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01740, 1660$ NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 1.20-1.38 (25H, m) , 1.59 (9H, s) , 1.52

N-(3-ヒドロキシプロピル)ヘキサンアミド1.75 gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-2-カルボニル)アミノ]プロピオネート

168

\* 実測値 620.4761

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 0.98 (3H, s) , 1.03 (3H, s) , 1.22-2.10 (36H, m) , 2.17 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.56 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 3.26 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.32 (2H, dt,  $J=6\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ) , 3.50-3.68 (4H, m) , 3.71 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.10 (1H, s) , 4.15 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 5.28-5.40 (2H, m) , 5.90-5.98 (1H, m) , 6.98-7.10 (1H, m)

10 実施例-54

3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(2-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-4-(トリメチルアセチル)オキシ-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート

\*

\* - 1.70 (2H, m) , 1.85 (2H, tt,  $J=7\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ) , 1.94-2.06 (6H, m) , 2.17 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.56 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 3.28-3.40 (2H, m) , 3.54-3.62 (2H, m) , 4.07 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.10-4.20 (2H, m) , 4.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 5.11 (1H, s) , 5.28-5.40 (2H, m) , 5.70 - 5.80 (1H, m) , 6.94-7.02 (1H, m)

実施例-55

3-(N-ヘキサンアミル)プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

\*

N-(3-ヒドロキシプロピル)ヘキサンアミド1.75 gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

(85)

169

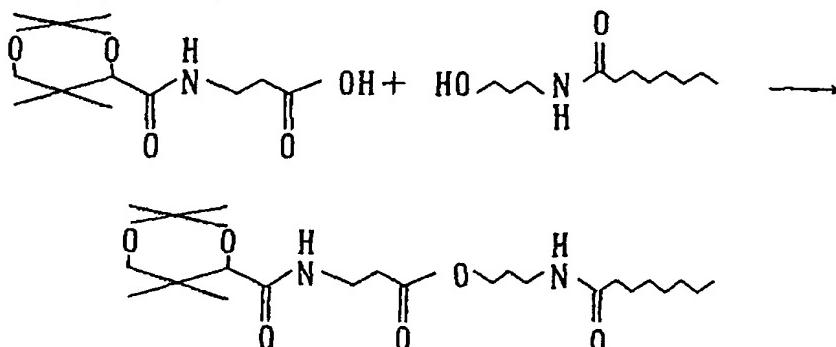
シ-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.90g(収率46%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; νC=O 1740, 1658質量分析 分子式; C<sub>21</sub>H<sub>38</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 414.2730

実測値 414.2741

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.90 (3H, t, J=7Hz),

性状；油状  
IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; νC=O 1740, 1658  
質量分析 分子式; C<sub>21</sub>H<sub>38</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>  
理論値 414.2730  
実測値 414.2741

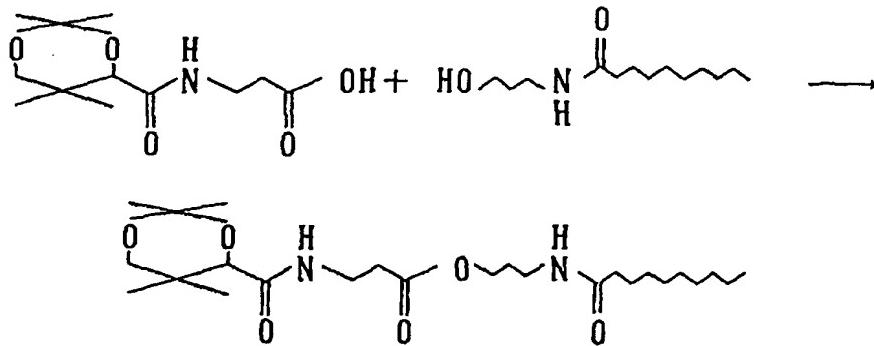
N-(3-ヒドロキシプロピル)オクタンアミド2.03gと3-(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ)プロピオン酸2.56gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.91g(収率66%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; νC=O 1738, 1658質量分析 分子式; C<sub>23</sub>H<sub>42</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 442.3043

実測値 442.3054



N-(3-ヒドロキシプロピル)デカンアミド2.29g 50 と3-(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ

(85)

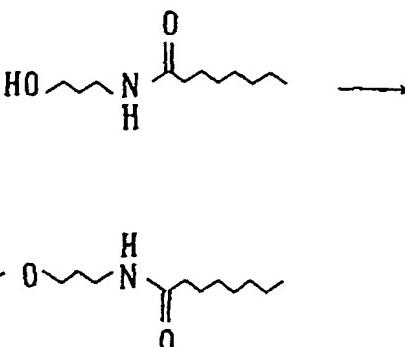
170

\* 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.22-1.36 (3H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.58-1.74 (1H, m), 1.85 (2H, tt, J=7Hz, 7Hz), 2.18 (2H, t, J=7Hz), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.33 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz), 3.46-3.66 (4H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.16 (2H, t, J=12Hz), 5.94-6.02 (1H, m), 6.92-7.04 (1H, m)

10 実施例-56

3-(N-オクタイルアミノ)プロピル 3-(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ)プロピオネート

\*

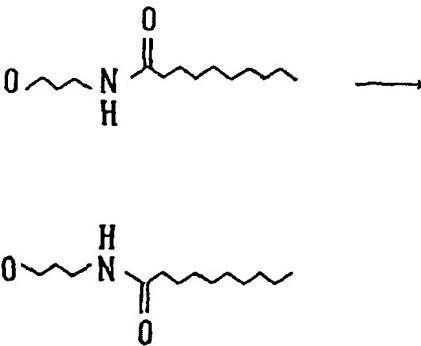


\* NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.20-1.36 (5H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.56-1.74 (3H, m), 1.84 (2H, tt, J=7Hz, 7Hz), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.33 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz), 3.46-3.66 (4H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.15 (2H, t, J=7Hz), 5.94-6.02 (1H, m), 6.92-7.04 (1H, m)

実施例-57

3-(N-デカノイルアミノ)プロピル 3-(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ)プロピオネート

\*



(86)

171

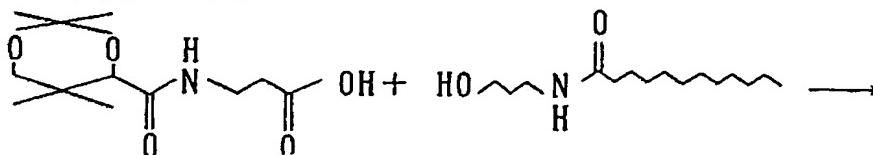
シ-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59g, ジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.61g(収率98%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=0$ 1740, 1662質量分析 分子式;  $C_{25}\text{H}_{46}\text{N}_2\text{O}_6$ 

理論値 470.3356

実測値 470.3377

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),

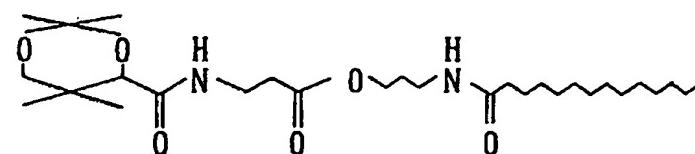
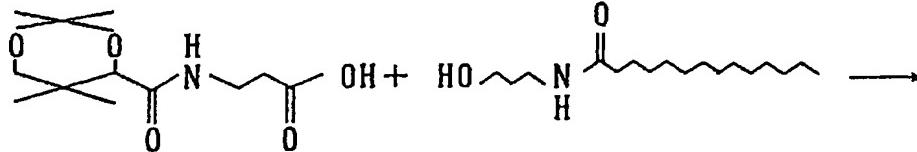
N-(3-ヒドロキシプロピル)ドデカンアミド2.57gと3-(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ)プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.19g(収率64%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=0$ 1738, 1660質量分析 分子式;  $C_{27}\text{H}_{50}\text{N}_2\text{O}_6$ 

理論値 498.3668

実測値 498.3676



40

(86)

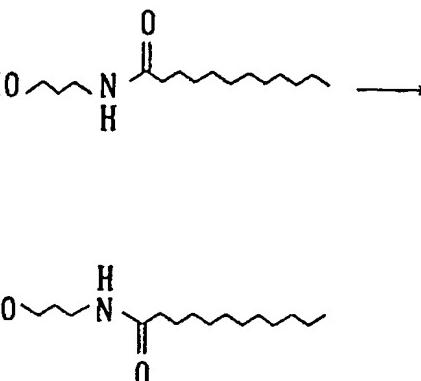
172

\* 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.20-1.34 (6H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.56-1.78 (4H, m), 1.82-1.94 (3H, m), 2.17 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 2.36-2.44 (1H, m), 2.56 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 3.29 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.33 (2H, dt,  $J=6\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ), 3.46-3.66 (4H, m), 3.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 4.08 (1H, s), 4.15 (2H, t,  $J=12\text{Hz}$ ), 5.92-6.02 (1H, m), 6.08-6.18 (1H, m), 6.92-7.07 (1H, m)

10 実施例-58

3-(N-デカノイルアミノ)プロピル 3-(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ)プロピオネート

\*

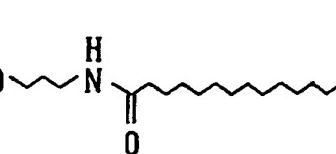
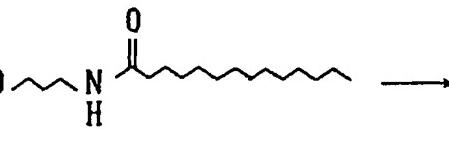


N-(3-ヒドロキシプロピル)ドデカンアミド2.57gと3-(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ)プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.19g(収率64%)を得た。

性状；油状

3-(N-テトラデカノイルアミノ)プロピル 3-(N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ)プロピオネート

40



(87)

173

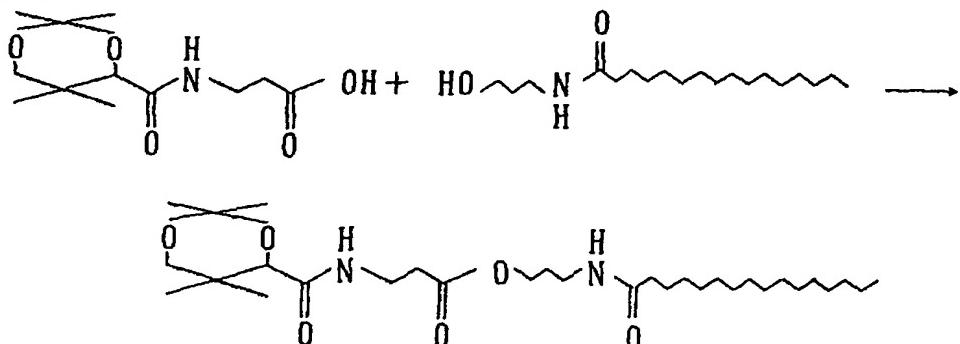
N-(3-ヒドロキシプロピル) テトラデカンアミド 2.87gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.63g(収率88%)を得た。

性状：油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; νC=01740, 1656質量分析 分子式: C<sub>29</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 526.3981

実測値 526.3983

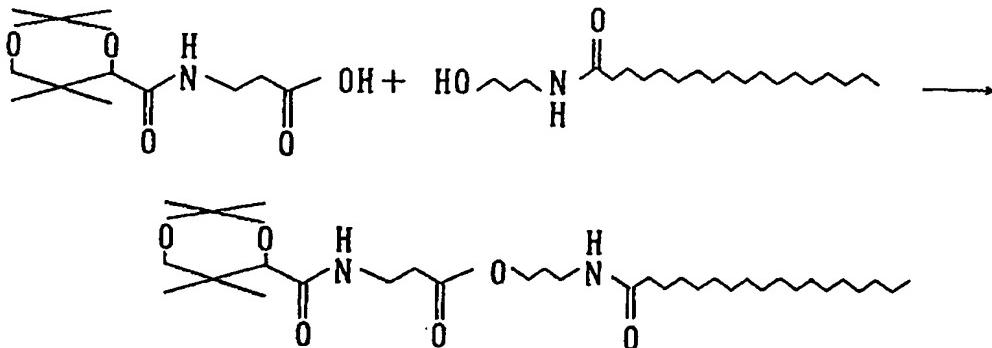


N-(3-ヒドロキシプロピル) ヘキサデカンアミド 3.13gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物5.48g(収率99%)を得た。

性状：油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; νC=01740, 1658質量分析 分子式: C<sub>31</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 554.4294



(87)

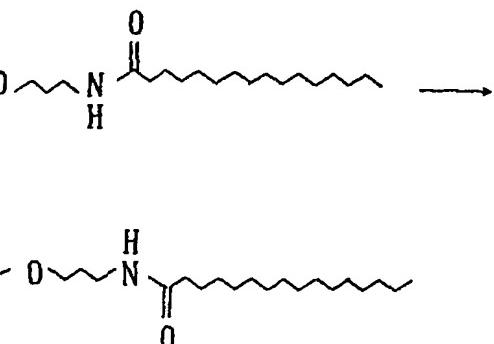
174

\* NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.20-1.34 (1H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.52-1.64 (4H, m), 1.84 (2H, tt, J=7Hz), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.36-2.44 (1H, m), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.33 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz), 3.48-3.66 (4H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.16 (2H, t, J=7Hz), 5.92-5.96 (1H, m), 6.90-7.02 (1H, m)

実施例-60

3-[N-(ヘキサデカノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

\*

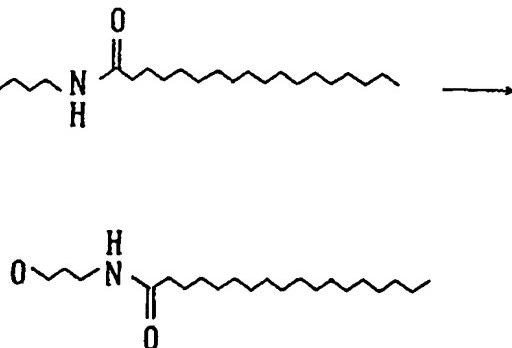


実測値 554.4301

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.21-1.36 (2H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.56-1.98 (6H, m), 1.84 (2H, tt, J=7Hz), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.32 (2H, dd, J=7Hz, 6Hz), 3.67 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.16 (2H, t, J=12Hz), 5.92-5.98 (1H, m), 6.92-7.04 (1H, m)

実施例-61

3-[N-(オクタデカノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート



(88)

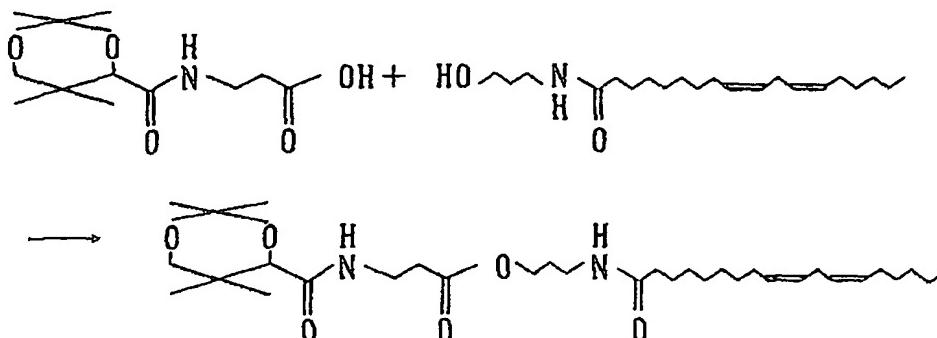
175

N-(3-ヒドロキシプロピル)オクタデカンアミド 3.42gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.90g(収率67%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01738, 1652$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{33}\text{H}_{62}\text{N}_2\text{O}_6$ 

理論値 582.4608



N-(3-ヒドロキシプロピル)リノレオイルアミド 3.38gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物を収率67%で得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01740, 1654$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{33}\text{H}_{58}\text{N}_2\text{O}_6$ 

理論値 578.4294

実測値 578.4291

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.89 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,

40

(88)

176

\* 実測値 582.4619

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 0.98 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.36 (17H, m) , 1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 1.54-1.96 (10H, m) , 2.17 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.56 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 3.28 (1H, t,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.33 (2H, dt,  $J=6\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ) , 3.44-3.62 (4H, m) , 3.67 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.08 (1H, s) , 4.16 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 5.96-6.02 (1H, m) , 6.92-7.04 (1H, m)

実施例-62

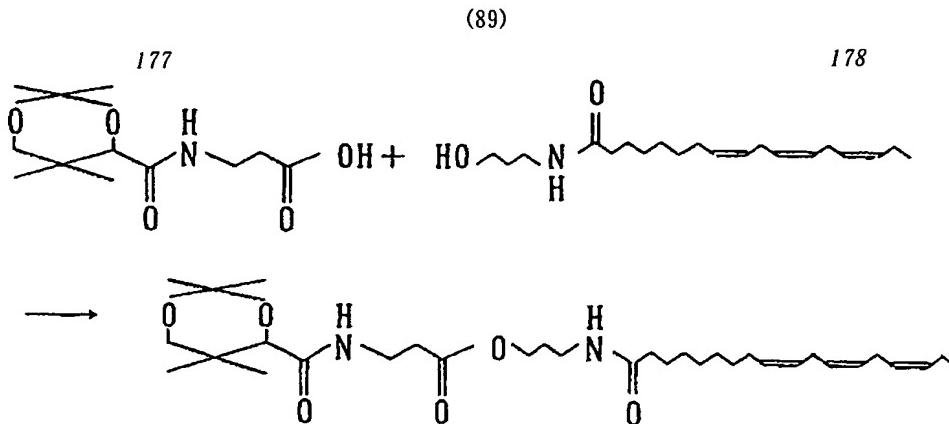
3-[N-(リノレオイルアミノ)プロピル]3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

\*

0.98 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.44 (17H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 1.52-1.76 (4H, m) , 1.84 (2H, tt,  $J=7\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ) , 2.00-2.10 (6H, m) , 2.17 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.36-2.44 (1H, m) , 2.56 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.77 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 3.29 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.32 (2H, dd,  $J=6\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ) , 3.46-3.64 (4H, m) , 3.67 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.08 (1H, s) , 4.16 (2H, t,  $J=12\text{Hz}$ ) , 5.28-5.42 (1H, m) , 5.92-6.00 (1H, m) , 6.94-7.02 (1H, m)

実施例-63

3-[N-(リノレオイルアミノ)プロピル]3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート



N-（3-ヒドロキシプロピル）リノレニルアミド3.35gと3-[N-（2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル）アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.09g（収率71%）を得た。

性状：油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) :  $\nu$  c=01738, 1652

質量分析 分子式： $C_{33}H_{56}N_2O_6$

理論値 576.4138

寒測值 576.4126

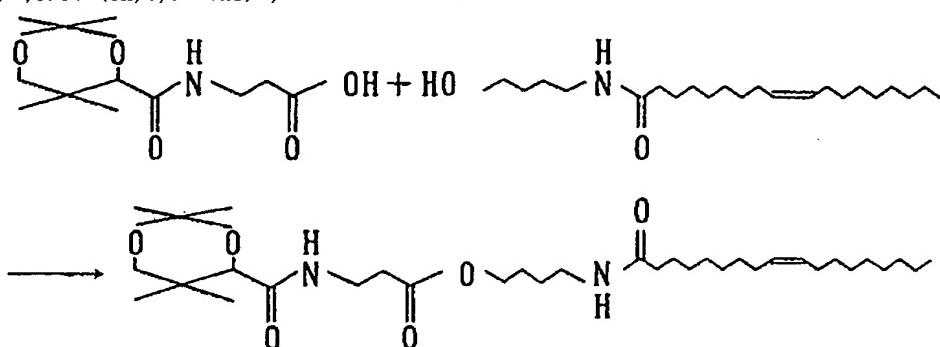
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0

~~1000~~

\* 0.98 (3H, s) , 1.05 (3H, s) , 1.26-1.44  
 (12H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.46 (3H, s) ,  
 1.53-1.74 (6H, m) , 1.80-1.92 (4H, m) ,  
 2.02-2.10 (2H, m) , 2.17 (2H, t, J=7Hz) ,  
 2.34-2.42 (2H, m) , 2.56 (2H, t, J=7Hz) ,  
 3.29 (1H, d, J=12Hz) , 2.74-2.86 (2H, m) ,  
 3.28 (1H, d, J=12Hz) , 3.32 (2H, dd, J=6Hz,  
 7Hz) , 3.42-3.66 (4H, m) , 3.68 (1H, d,  
 J=12Hz) , 4.07 (1H, s) , 4.15 (2H, t, J=  
 12Hz) , 5.26-5.44 (6H, m) , 5.90-6.00  
 (1H, m) , 6.92-7.06 (1H, m)

寒施例-64

4-(N-オレオイルアミノ) プチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート



N-（4-ヒドロキシブチル）オレオイルアミド3.54gと3-[N-（2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル）アミノ]プロピオニ酸2.59gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物5.05g（収率85%）を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) :  $\nu \approx 1740, 1662$

質量分析 分子式： $C_{34}H_{62}N_2O_6$

理論值 594.4608

寒測值 594.4618

40 NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97  
 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.20-1.40 (23H,  
 m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.50-  
 1.80 (6H, m), 1.86-2.10 (3H, m), 2.17  
 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz), 2.56 (2H, t, J=6Hz)  
 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.40-3.66 (2H, m),  
 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s),  
 4.12 (2H, t, J=6Hz), 5.30-5.40 (2H, m),  
 5.48-5.56 (1H, m), 6.90-7.00 (1H, m)

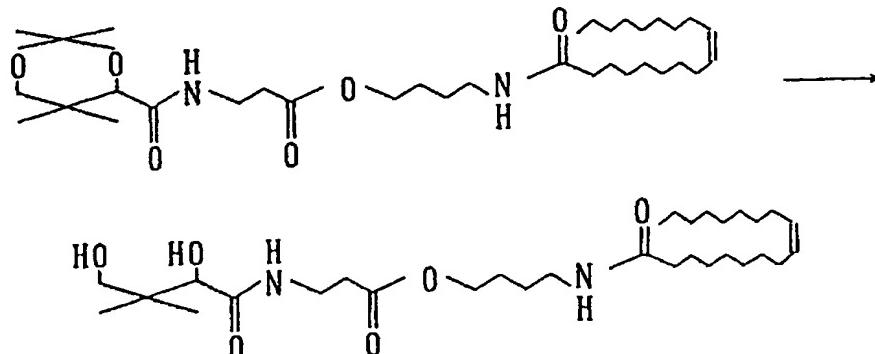
実施例-65

50 4-(N-オレオイルアミノ) プチル 3-(N-(2,

(90)

179

4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル \* \* アミノ] プロピオネート



4-(N-オレオイルアミノ) ブチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート 0.59gを酢酸20mlと水10mlの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後減圧で溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.50g(収率91%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=1740, 1658$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{31}\text{H}_{58}\text{N}_2\text{O}_6$ 

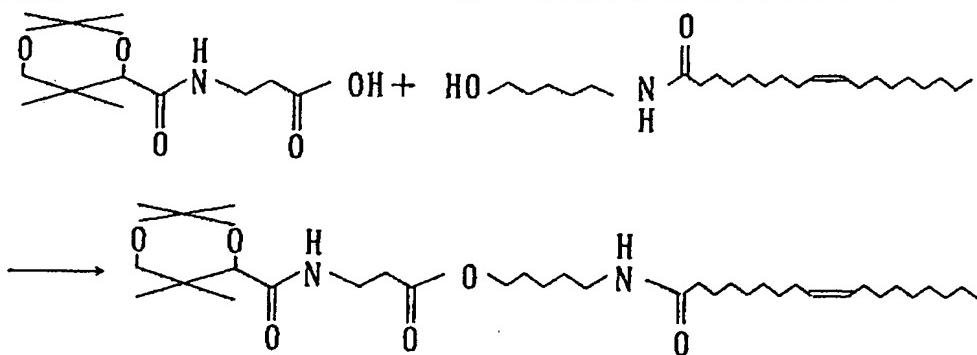
理論値 554.4293

実測値 554.4291

※NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 0.94 (3H, s) , 1.01 (3H, s) , 1.18-1.42 (2H, m) , 1.50-1.80 (6H, m) , 1.90-2.12 (3H, m) , 2.18 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.45-2.57 (2H, m) , 3.10-3.80 (8H, m) , 4.02 (1H, m) , 4.05-4.13 (1H, m) , 4.18-4.26 (1H, m) , 5.30-5.41 (2H, m) , 5.88-5.96 (1H, m) , 7.34-7.44 (1H, m)

## 実施例-66

5-(N-オレオイルアミノ) ペンチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート



N-(5-ヒドロキシペンチル) オレオイルアミド3.68gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオニ酸2.59gとジシクロヘキシカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.99g(収率82%)を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=1738, 1658$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{35}\text{H}_{64}\text{N}_2\text{O}_6$ 

理論値 608.4764

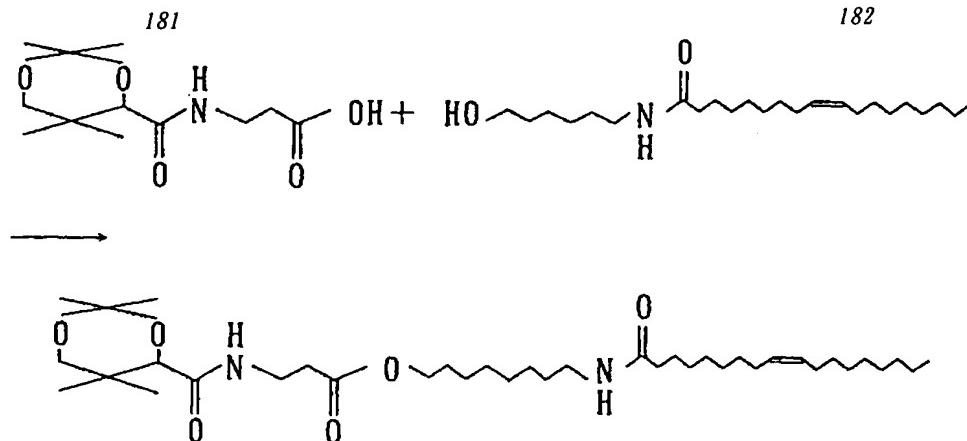
実測値 608.4764

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.80 (2H, m) , 1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 1.84-2.10 (4H, m) , 2.15 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 2.56 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 3.25 (1H, dt,  $J=6\text{Hz}$ , 6Hz) , 3.29 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.40-3.68 (4H, m) , 3.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.08 (1H, s) , 4.10 (2H, t,  $J=12\text{Hz}$ ) , 5.30-5.40 (2H, m) , 5.48-5.54 (1H, m) , 6.90-7.02 (1H, m)

## 実施例-67

5-(N-オレオイルアミノ) ヘキシル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

(91)



N-(6-ヒドロキシヘキシル)オレオイルアミド3.82gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.80g(収率45%)を得た。

性状：油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01740, 1656$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{36}\text{H}_{66}\text{N}_2\text{O}_6$ 

理論値 622.4920

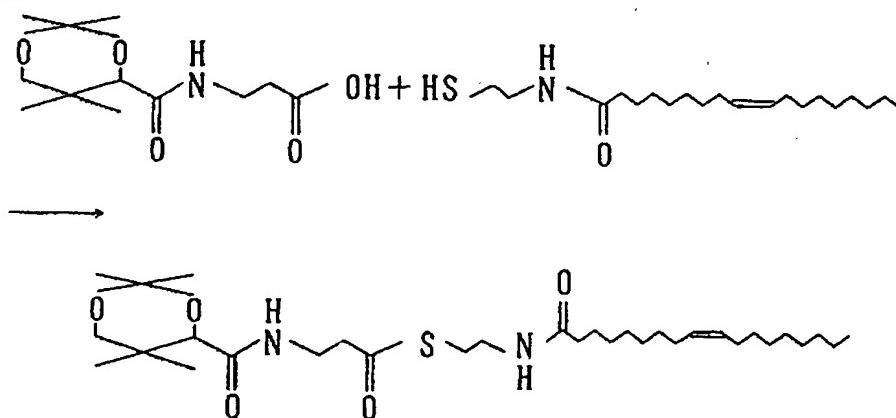
実測値 633.4923

\* NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.54  
(24H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) ,  
1.56-1.70 (6H, m) , 1.90-2.10 (4H, m) ,  
2.15 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.55 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) ,  
3.24 (1H, dt,  $J=6\text{Hz}, 6\text{Hz}$ ) , 3.29 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.  
40-3.66 (2H, m) , 3.68 (1H, d,  
20  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.08 (1H, s) , 4.09 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 5.30-5.40 (2H, m) , 5.40-5.50  
(1H, m) , 6.92-7.02 (1H, m)

## 実施例-68

S-[2-(N-オレオイルアミノ)エチル]3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンチオエート

\*



N-(2-メルカブトエチル)オレオイルアミド3.42gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシリカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.77g(収率82%)を得た。

性状：油状

40 IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01730, 1656$ 質量分析 分子式;  $\text{C}_{32}\text{H}_{58}\text{N}_2\text{O}_5\text{S}$ 

理論値 582.4123

実測値 582.4095

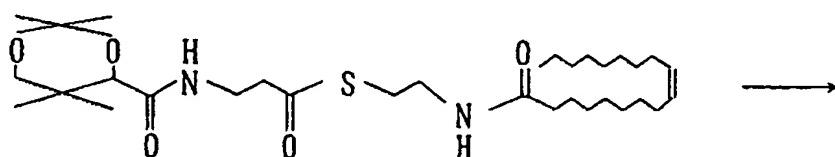
NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) ,  
0.98 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.40  
(19H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) ,  
1.58-1.70 (2H, m) , 1.84-2.10 (4H, m) ,  
2.17 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.78-2.86 (2H, m) ,  
3.05 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 3.29 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) ,  
3.35-3.62 (5H, m) , 3.67 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) ,

(92)

183

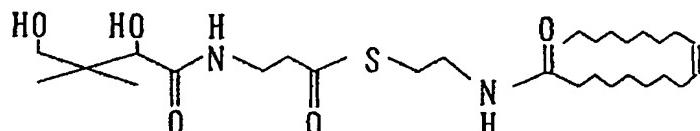
4.07 (1H, s), 5.34-5.41 (2H, m), 5.93  
- 6.02 (1H, m), 6.83-6.92 (1H, m)

実施例-69



184

\* S - [2 - (N - オレオイルアミノ) エチル] 3 -  
[N - (2, 4 - ジヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - オキ  
\* ソブチル) アミノ] プロパンチオエート



S - [2 - (N - オレオイルアミノ) エチル] 3 -  
[N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4  
- カルボニル) アミノ] プロパンチオエート 0.58g を酢  
酸 20ml と水 10ml の混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌し  
た。反応終了後減圧で溶媒を留去し、残留物を、シリカ  
ゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合  
物 0.16g (収率 29%) を得た。

性状；油状

IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01650$ 質量分析 分子式;  $C_{29}H_{54}N_2O_5S$ 

理論値 542.3753

実測値 542.3765

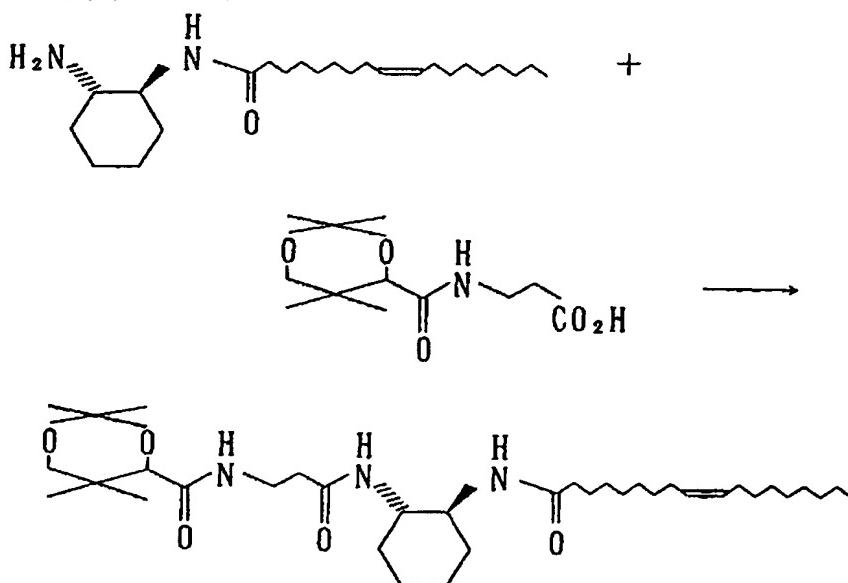
NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),

※ 0.93 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.15-1.40  
(16H, m), 1.50-1.70 (2H, m), 1.90-  
2.06 (4H, m), 2.17 (2H, t,  $J=8\text{Hz}$ ), 2.25  
- 2.60 (6H, m), 2.70-2.80 (1H, m), 2.82  
- 2.98 (2H, m), 3.05-3.15 (1H, m), 3.30  
- 3.52 (6H, m), 4.01 (1H, s), 5.30-5.42  
20 (2H, m), 5.90-6.00 (1H, brs), 7.22-  
7.32 (1H, brs)

実施例-70

N - [(1S, 2S) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘ  
キサン - 1 - イル] - 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメ  
チル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プ  
ロパンアミド

※ ロパンアミド



3 - N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン  
- 4 - カルボニル) アミノ] プロピオン酸 745mg, N -  
(2 - アミノシクロヘキシル) オレオイルアミド 800mg  
と塩酸 1 - エチル - 3 - (3 - ジメチルアミノ) プロピ  
オル カルボジイミド g とを塩化メチレン 50ml に溶かし、  
一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸  
ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物を、シリ

カゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化  
合物 504mg (収率 34%) を得た。

性状；油状

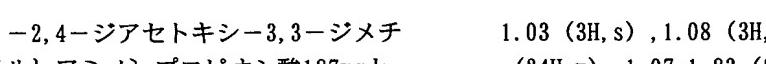
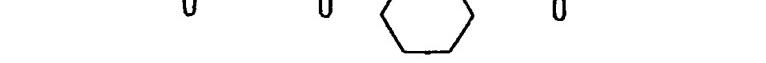
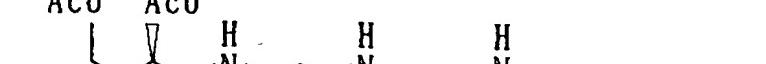
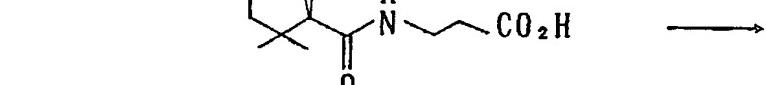
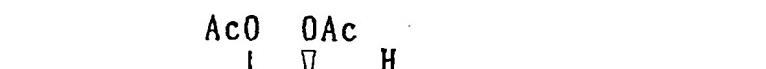
旋光度 [ $\alpha$ ] D ; -15.1° (C = 1.0,  $\text{CHCl}_3$ )IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01660, 1642$ 質量分析 分子式;  $C_{36}H_{65}N_3O_5$ 

理論値 619.4924

(93)

185

実測値 619.4913  
 NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.15-1.37 (24H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.50-1.62 (2H, m), 1.68-1.82 (2H, m), 1.90-2.08 (6H, m), 2.11 (2H, t, J=7Hz), 2.28-2.44 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.36-3.48 (1H, m), 3.55-3.68 (3H, m),



3-N-[(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル]アミノ]プロピオン酸187mgと  
 (1S,2S)-N-(2-アミノシクロヘキシリ)オレオイルアミド172mgと塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドgとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物194mg(収率56%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]$  D ; -3.10° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu$  C=O 1750, 1660質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 663.4822

実測値 663.4833

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz),

(93)

186

\* 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, d, J=11Hz), 5.29-5.40 (2H, m), 5.84 (1H, brs), 6.38 (1H, brs), 7.00 (1H, t, J=6Hz)

実施例-71

N-[((1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル)-3-[N-((2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

\*

3-N-[(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル]アミノ]プロピオン酸187mgと  
 (1S,2S)-N-(2-アミノシクロヘキシリ)オレオ

イルアミド172mgと塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドgとを塩化メチ

レン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物194mg(収率56%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]$  D ; -3.10° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu$  C=O 1750, 1660

質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 663.4822

実測値 663.4833

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) : 0.88 (3H, t, J=7Hz),

1.03 (3H, s), 1.08 (3H, s), 1.18-1.39

(24H, m), 1.07-1.83 (2H, m), 1.92-

2.09 (6H, m), 2.08 (3H, s), 2.14 (2H, t,

J=7Hz), 2.20 (3H, s), 2.32 (2H, t, J=7

Hz), 3.28-3.40 (1H, m), 3.49-3.59 (2H,

m), 3.61-3.74 (1H, m), 3.82 (1H, d, J=

12Hz), 4.04 (1H, d, J=12Hz), 4.09 (1H,

s), 5.29-5.40 (2H, m), 5.79 (1H, d, J=

8Hz), 6.19 (1H, d, J=8Hz), 7.03 (1H,

t, J=6Hz)

実施例-72

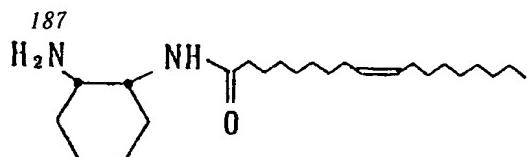
N-[2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-

イル]-3-[N-((2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-

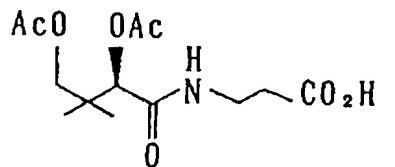
-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミ

ド

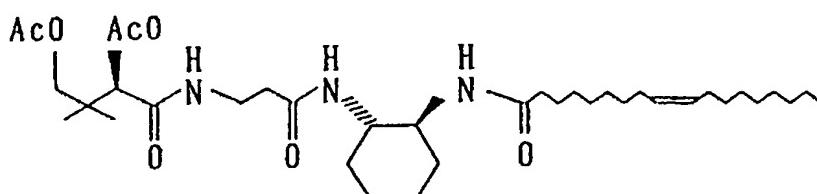
(94)



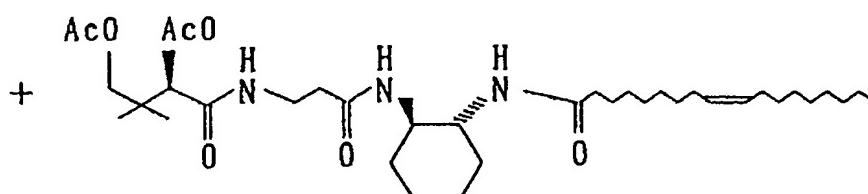
188



+



(B)



(A)

3 - [N - (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロピオニ酸 1.01g と N - (2-アミノシクロヘキシリ) オレオイルアミド 1.26g と塩酸 1-エチル-3 - (3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド 1.91g をと塩化メチレン 50ml に溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物に 2 種のジアステレオマー A [N - [(1R, 2R)-2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル] - 3 - [N - [(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル] アミノ] プロパンアミド] 及び B [N - [(1S, 2S)-2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル] - 3 - [N - [(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル] アミノ] プロパンアミド] を各々 603mg (収率 28%) 及び 714mg (収率 33%) を得た。

A

性状；油状

旋光度  $[\alpha]$  D ;  $-32.0^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01750, 1660$ 質量分析 分子式 ;  $\text{C}_{37}\text{H}_{65}\text{N}_3\text{O}_7$ 

理論値 663.4822

実測値 663.4834

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),  
 1.08 (3H, s), 1.10 (3H, s), 1.21-1.38  
 (24H, m), 1.46-1.65 (2H, m), 1.69-  
 1.79 (2H, m), 1.88-2.08 (6H, m), 2.08  
 (3H, s), 2.13 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 2.14-2.26  
 (1H, m), 2.16 (3H, s), 2.23-2.42 (1H,  
 m), 3.06-3.16 (1H, m), 3.56-3.79 (3H,  
 m), 3.90 (1H, d,  $J=11\text{Hz}$ ), 4.07 (1H, d,  
 $J=11\text{Hz}$ ), 4.80 (1H, s), 5.29-5.42 (1H,  
 m), 5.69 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.56 (1H, d,  $J=$   
 8Hz), 7.41 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ )

B

性状；油状

旋光度  $[\alpha]$  D ;  $-3.10^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C}}=01750, 1660$ 質量分析 分子式 ;  $\text{C}_{37}\text{H}_{65}\text{N}_3\text{O}_7$ 

理論値 663.4822

実測値 663.4833

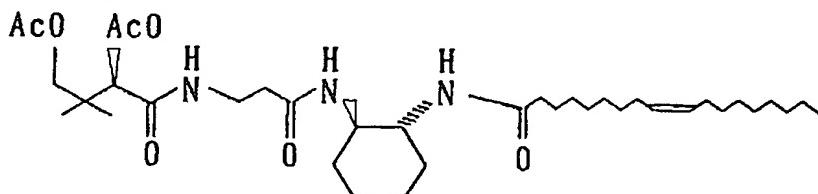
NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),  
 1.03 (3H, s), 1.08 (3H, s), 1.18-1.39

(95)

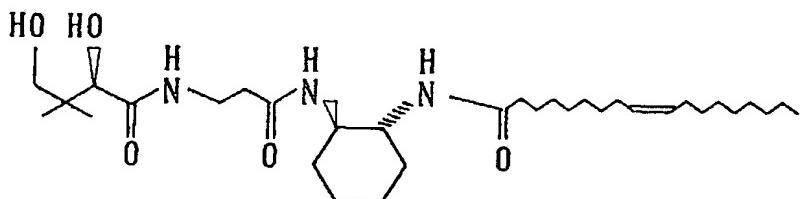
189

(24H, m), 1.07-1.83 (2H, m), 1.92-  
2.09 (6H, m), 2.08 (3H, s), 2.14 (2H, t,  
 $J=7\text{Hz}$ ), 2.20 (3H, s), 2.32 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),  
3.28-3.40 (1H, m), 3.49-3.59 (2H, m),  
3.61-3.74 (1H, m), 3.82 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ),  
4.04 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 4.09 (1H, s),  
5.29-5.40 (2H, m), 5.79 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ),

\*



→



N - [(1R, 2R) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン - 1 - イル] - 3 - [N - {(2R) - 2, 4 - ジアセトキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - オキソブチル} アミノ] プロパンアミド 380mg メタノール 10ml に溶かし、室温攪拌下に 1 規定カセイソーダ水溶液 0.5ml を加え、2 時間攪拌した。反応終了後、減圧下で溶媒を留去し、酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物 293mg (収率 89%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$  ; +34.1° (C = 1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_C$  = 01642質量分析 分子式; C<sub>33</sub>H<sub>61</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 579.4611

190

\* 6.19 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 7.03 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ )

実施例-73

N - [(1R, 2R) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン - 1 - イル] - 3 - [N - {(2R) - 2, 4 - ジヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - オキソブチル} アミノ] プロパンアミド

\*

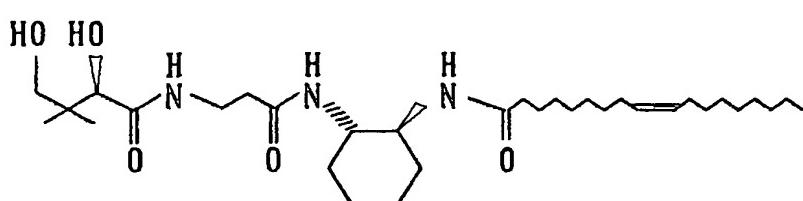
実測値 579.4596

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),  
0.95 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.17-1.38  
(24H, m), 1.49-1.62 (2H, m), 1.73-  
1.82 (2H, m), 1.93-2.08 (6H, m), 2.14  
(2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 2.31-2.45 (2H, m),  
2.52-2.86 (2H, m), 3.44-3.73 (6H, m),  
3.98 (1H, s), 5.28-5.40 (2H, m), 6.08  
(1H, brs), 6.63 (1H, brs), 7.34 (1H, t,  
 $J=6\text{Hz}$ )

実施例-74

N - [(1S, 2S) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン - 1 - イル] - 3 - [N - {(2R) - 2, 4 - ジヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - オキソブチル} アミノ] プロパンアミド

→



(96)

191

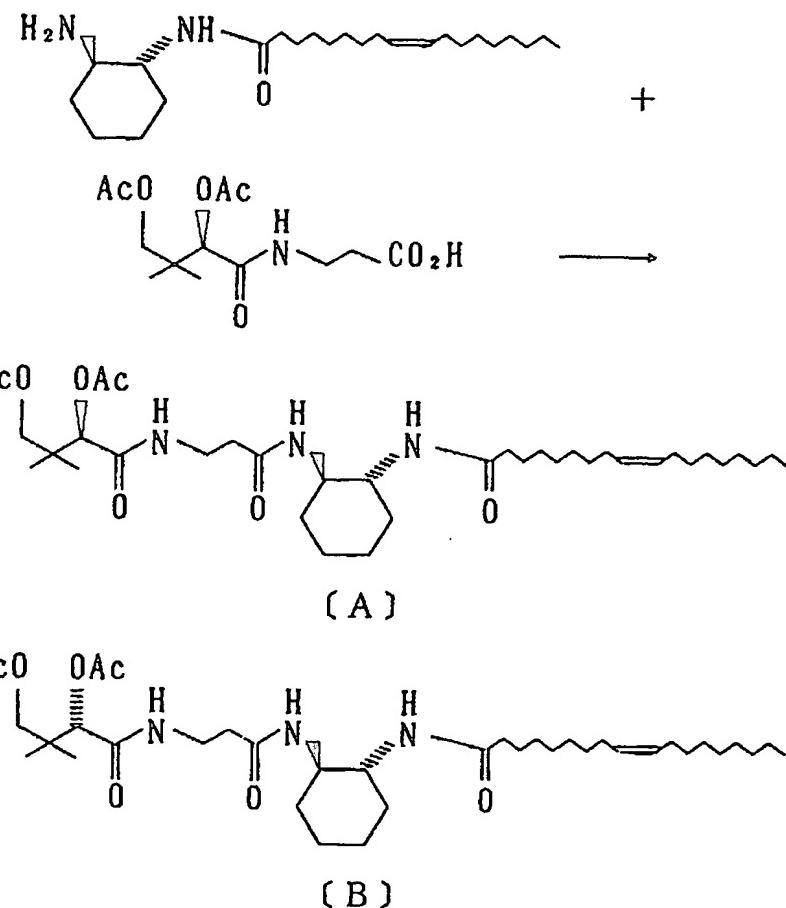
N-[(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N-[(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル]アミノ]プロパンアミド485mgメタノール10mlに溶かし、室温攪拌下に1規定カセイソーダ水溶液0.5mlを加え、2時間攪拌した。反応終了後、減圧下で溶媒を留去し、酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物410mg(収率97%)を得た。

性状：油状

旋光度  $[\alpha]$  D : -0.60° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1644質量分析 分子式 : C<sub>33</sub>H<sub>61</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 579.4611

実測値 579.4603



d1-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオン酸1.51gと(1R,2R)-N-(2-アミノシクロヘキシル)オレオイルアミド1.90gと塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド1.91gとを塩化メレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供

し精製し、標記化合物に2種のジアステロマーA [N-(1R,2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N-[(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル]アミノ]プロパンアミド] 及びB [N-(1R,2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N-[(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル]アミノ]プロパンアミドを各々848mg(収率97%)を得た。

192

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.94 (3H, s), 1.05 (3H, s), 1.16-1.38 (2H, m), 1.46-1.62 (2H, m), 1.71-1.82 (2H, m), 1.87-2.07 (6H, m), 2.12 (2H, t, J=7Hz), 2.32-2.44 (1H, m), 2.48-2.58 (1H, m), 2.63-3.05 (2H, m), 3.18-3.29 (1H, m), 3.46 (1H, d, J=11Hz), 3.51 (1H, d, J=11Hz), 3.55-3.73 (2H, m), 3.86-3.99 (1H, m), 4.12 (1H, s), 5.29-5.41 (2H, m), 5.99 (1H, d, J=8Hz), 7.02 (1H, d, J=8Hz), 7.11-7.19 (1H, m)

実施例-75

N-[(2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル)-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

(97)

193

率28%) 及び1.00g(収率33%)を得た。

〔A〕

性状; 油状

旋光度  $[\alpha]_D$ ; -32.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat); ν C=01750, 1660質量分析 分子式; C<sub>37</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 663.4822

実測値 663.4834

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>): 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.08 (3H, s), 1.10 (3H, s), 1.21-1.38 (24H, m), 1.46-1.65 (2H, m), 1.69-1.79 (2H, m), 1.88-2.08 (6H, m), 2.08 (3H, s), 2.13 (2H, t, J=7Hz), 2.14-2.26 (1H, m), 2.16 (3H, s), 2.23-2.42 (1H, m), 3.06-3.16 (1H, m), 3.56-3.79 (3H, m), 3.90 (1H, d, J=11Hz), 4.07 (1H, d, J=11Hz), 4.80 (1H, s), 5.29-5.42 (1H, m), 5.69 (1H, d, J=8Hz), 6.56 (1H, d, J=8Hz), 7.41 (1H, t, J=6Hz)

〔B〕

性状; 油状

194

\* 旋光度  $[\alpha]_D$ ; +2.04° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat); ν C=01750, 1660質量分析 分子式; C<sub>37</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 663.4822

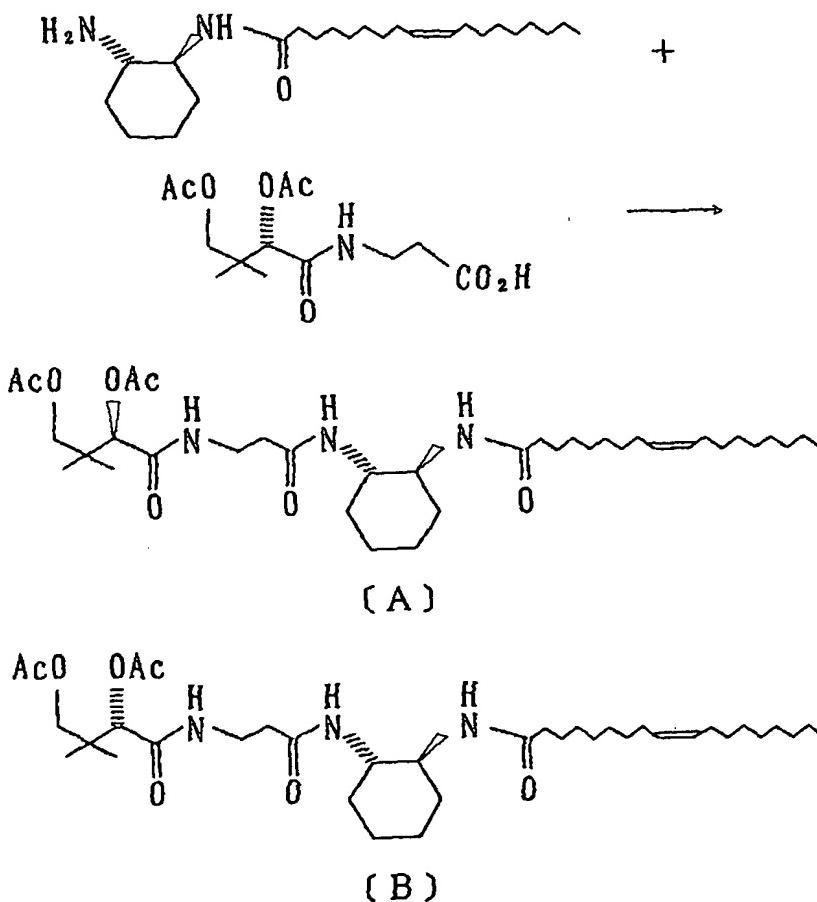
実測値 663.4833

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>): 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.03 (3H, s), 1.08 (3H, s), 1.18-1.39 (24H, m), 1.07-1.83 (2H, m), 1.92-2.09 (6H, m), 2.08 (3H, s), 2.14 (2H, t, J=7Hz), 2.20 (3H, s), 2.32 (2H, t, J=7Hz), 3.28-3.40 (1H, m), 3.49-3.59 (2H, m), 3.61-3.74 (1H, m), 3.82 (1H, d, J=12Hz), 4.04 (1H, d, J=12Hz), 4.09 (1H, s), 5.29-5.40 (2H, m), 5.79 (1H, d, J=8Hz), 6.19 (1H, d, J=8Hz), 7.03 (1H, t, J=6Hz)

実施例-76

N-〔2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-〔N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ〕プロパンアミド

\*



d1-3-〔N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ〕プロピオン酸1.44gと(1S,2S)-N-(2-アミノシクロヘキシリル)オレオイルアミド1.80gと塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノ)プロピルカルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液

(98)

195

を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物に2種のジアステレオマーA [N-(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N-[(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル]アミノ]プロパンアミド] 及びB [N-[(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N-[(2S)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル]アミノ]プロパンアミド]を各各859mg(収率29%)及び0.80g(収率27%)を得た。

〔B〕

性状；油状

旋光度  $[\alpha]$  D ; -32.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C</sub>=01750, 1660質量分析 分子式 ; C<sub>37</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

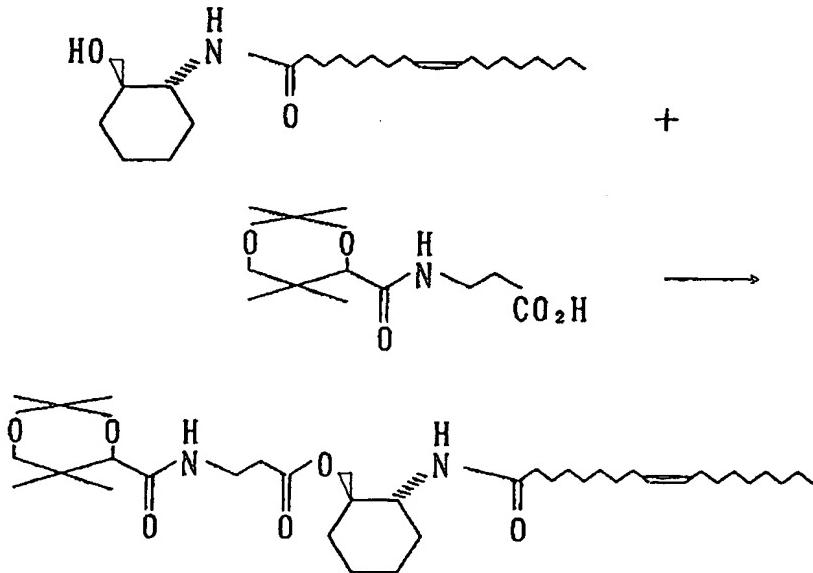
理論値 663.4822

\* 実測値 663.4834

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.08 (3H, s), 1.10 (3H, s), 1.21-1.38 (24H, m), 1.46-1.65 (2H, m), 1.69-1.79 (2H, m), 1.88-2.08 (6H, m), 2.08 (3H, s), 2.13 (2H, t, J=7Hz), 2.14-2.26 (1H, m), 2.16 (3H, s), 2.23-2.42 (1H, m), 3.06-3.16 (1H, m), 3.56-3.79 (3H, m), 3.90 (1H, d, J=11Hz), 4.07 (1H, d, J=11Hz), 4.80 (1H, s), 5.29-5.42 (1H, m), 5.69 (1H, d, J=8Hz), 6.56 (1H, d, J=8Hz), 7.41 (1H, t, J=6Hz)

実施例-77

(1R,2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート



(1R,2R)-2-(N-オレオイルアミノ)シクロヘキサンオール3.79gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオニ酸2.59gとジシクロヘキシカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.27g(収率53%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]$  D ; +26.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C</sub>=01736, 1654質量分析 分子式 ; C<sub>36</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 620.4764

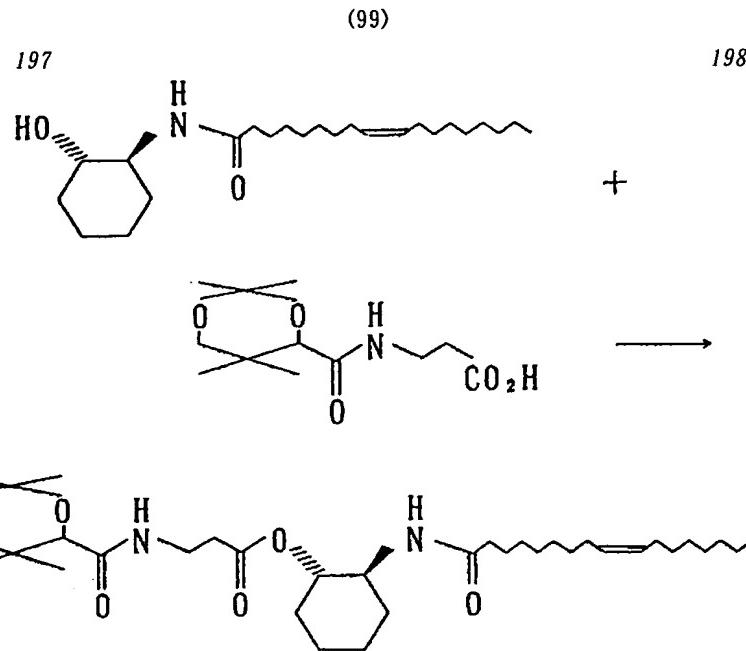
実測値 620.4759

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.07-1.39 (24H, m), 1.43 (3H, s), 1.48 (3H, s), 1.50-1.83 (4H, m), 1.92-2.17 (6H, m), 2.10 (2H, t, J=7Hz), 2.51 (2H, t, J=6Hz), 3.32-3.43 (1H, m), 3.57-3.68 (1H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.83-3.95 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.64 (1H, td, J=11Hz, 5Hz), 5.28-5.40 (1H, m), 5.74 (1H, d, J=8Hz), 6.95 (1H, t, J=6Hz)

実施例-78

(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

50



(1S, 2S) - 2 - (N - オレオイルアミノ) シクロヘキサノール 3.79g と 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオノン酸 2.59g と ジシクロヘキシルカルボジイミド 2.06g 及び 4 - (N, N - ジメチルアミノ) ピリジン 1.22g をトルエン 30ml に溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を 1 規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物 3.52g (収率 57%) を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$  : +14.3° (C = 1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_C$  = 01734, 1654

質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

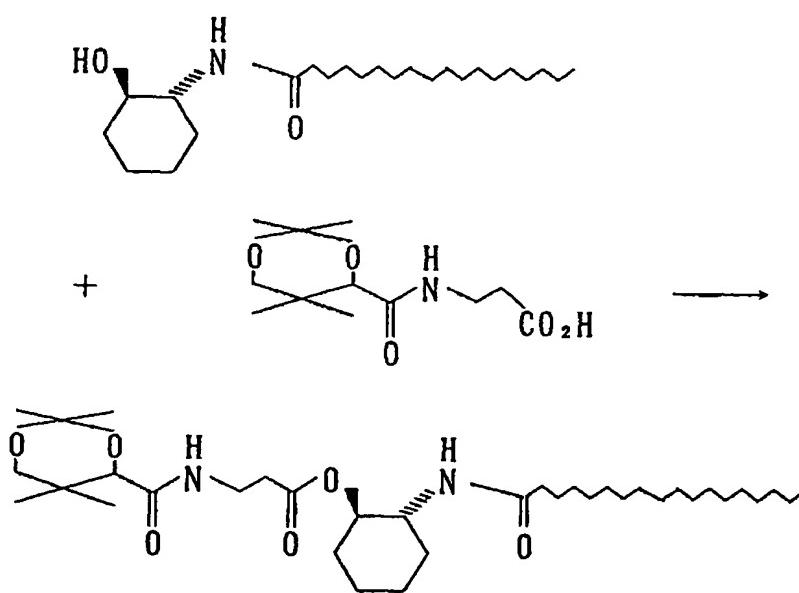
理論値 620.4764

実測値 620.4777

<sup>20</sup> NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J = 7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.06-1.38 (24H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.48-1.80 (4H, m), 1.92-2.17 (6H, m), 2.10 (2H, t, J = 7Hz), 2.51 (2H, t, J = 6Hz), 3.28 (1H, d, J = 12Hz), 3.45-3.57 (2H, m), 3.69 (1H, d, J = 12Hz), 3.82-3.93 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.64 (1H, td, J = 11Hz, 5Hz), 5.79 (1H, d, J = 8Hz), 6.91 (1H, t, J = 6Hz)

実施例-79

<sup>30</sup> (1R, 2R) - 2 - (ステアロイルアミノ) シクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート



(100)

199

(1R, 2R) - 2 - (N-ステアロイルアミノ) シクロヘキサノール 3.81g と 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸 2.59g と ジシクロヘキシルカルボジイミド 2.06g 及び 4 - (N, N-ジメチルアミノ) ピリジン 1.22g をトルエン 30ml に溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈澱物を除き、有機層を 1 規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物 2.82g (収率 45%)を得た。

性状；融点 69.1~70.2°C

旋光度  $[\alpha]$  D ; +25.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν C=01734, 1660, 1646質量分析 分子式 ; C<sub>36</sub>H<sub>66</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 622.4920

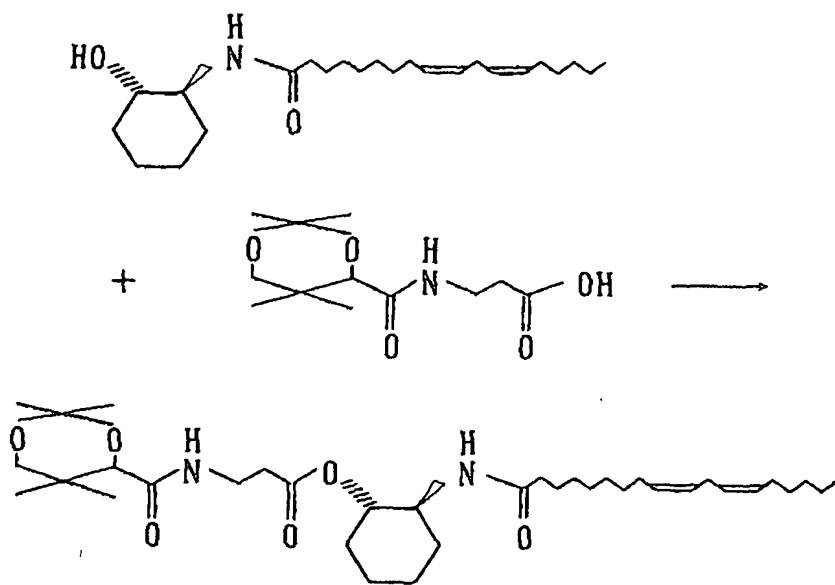
\* 実測値 622.4930

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.11-1.34 (32H, m), 1.43 (3H, s), 1.48 (3H, s), 1.50-1.83 (4H, m), 1.92-2.18 (2H, m), 2.10 (2H, t, J=7Hz), 2.51 (2H, t, J=6Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.31-3.42 (1H, m), 3.57-3.68 (1H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.83-3.95 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.64 (1H, td, J=11Hz, 5Hz), 5.74 (1H, d, J=8Hz), 6.95 (1H, t, J=6Hz)

実施例-80

(1S, 2S) - 2 - (リノレオイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオ

\* ネート



(1S, 2S) - 2 - (N-リノレオイルアミノ) シクロヘキサノール 3.77g と 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸 2.59g と ジシクロヘキシルカルボジイミド 2.06g 及び 4 - (N, N-ジメチルアミノ) ピリジン 1.22g をトルエン 30ml に溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈澱物を除き、有機層を 1 規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物 2.72g (収率 44%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]$  D ; +13.5° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν C=01736, 1654質量分析 分子式 ; C<sub>36</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

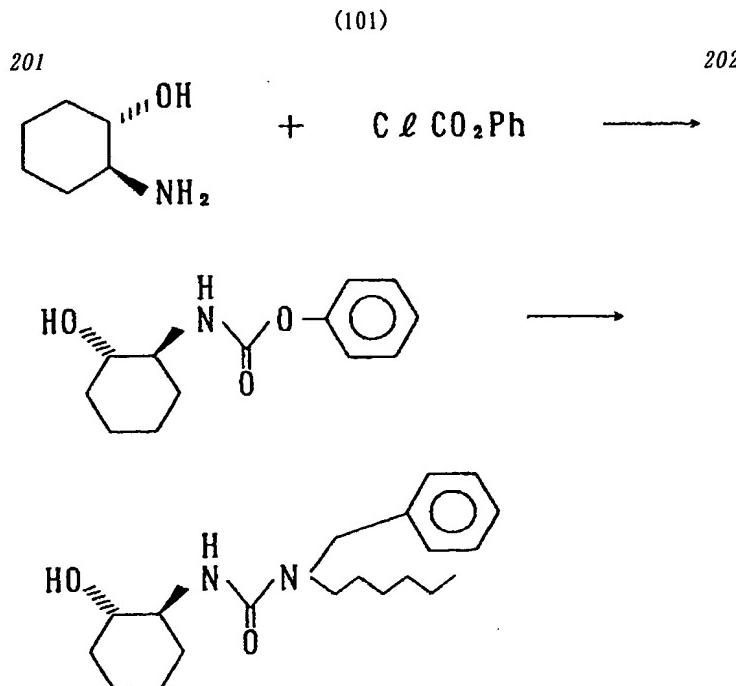
理論値 618.4607

実測値 618.4612

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.11-1.39 (18H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.51-1.81 (4H, m), 1.95-2.18 (6H, m), 2.10 (2H, t, J=7Hz), 2.50 (2H, t, J=6Hz), 2.77 (1H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.46-3.57 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.32-3.43 (1H, m), 4.09 (1H, s), 4.64 (1H, td, J=11Hz, 5Hz), 5.28-5.43 (4H, m), 5.80 (1H, d, J=8Hz), 6.91 (1H, t, J=6Hz)

参考例22

(1S, 2S) - 2 - (N-ベンジル-N-ヘキシルカルバモイル) アミノシクロヘキサノール



(1S, 2S) - 2-アミノシクロヘキサノール345mg及び  
炭酸ナトリウム424mgを酢酸エチル10ml及び水10mlに溶  
かし氷冷攪拌下にクロル炭酸フェニル470mgを酢酸エチ  
ル5mlに溶かした溶液を滴下し、滴下終了後2時間攪拌  
した。反応終了後、水層を分取し酢酸エチルにより抽出  
後、有機層を合せ、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸ナ  
トリウムで乾燥後溶媒を留去し、得られた残留物に、N  
-ベンジルヘキシリアルミン1.15gを加え、100°Cで1時間  
攪拌した。反応終了後、残留物をシリカゲルクロマトグラ\*

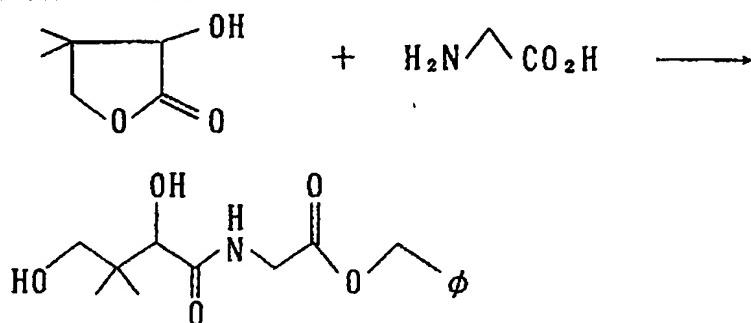
\* ラフィーに供し精製し標記化合物866mg（収率87%）を  
20 得た。

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>)

0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.96-2.08 (16H, m), 3.15  
- 3.54 (4H, m), 4.25 (1H, d, J=6Hz), 4.47 (2H,  
s), 4.67 (1H, d, J=3Hz), 7.20-7.41 (5H, m)

#### 参考例23

ベンジル 2-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメ  
チルブタノイル)アミノ]アセテート



パントイルラクトン13.0gとグリシン8.3g及び85%水  
酸化カリウムとをメタノール100mlに溶かし、3時間加  
熱還流した。反応液を減圧下、溶媒を留去した。残留物  
を乾燥後、ジメチルホルムアミド150mlに溶かし、ベン  
ジルプロマイド18.8gを加え室温で20時間攪拌した。反  
応液を減圧下留去し、残留物を水に溶かし酢酸エチルで  
抽出した。有機層を水、次いで飽和食塩水で洗浄し、無  
水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去し、残留物をシリ  
カゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記  
化合物12.8g (43%)を得た。

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>)

40 0.95 (3H, s), 1.06 (3H, s), 2.73 (2H, br-s),  
3.51 (1H, d, J=11Hz), 3.56 (1H, d, J=11Hz),  
4.03-4.21 (2H, m), 4.09 (1H, s), 5.19 (2H, s),  
7.23-7.28 (1H, m), 7.33-7.42 (5H, m)

#### 実施例81～164

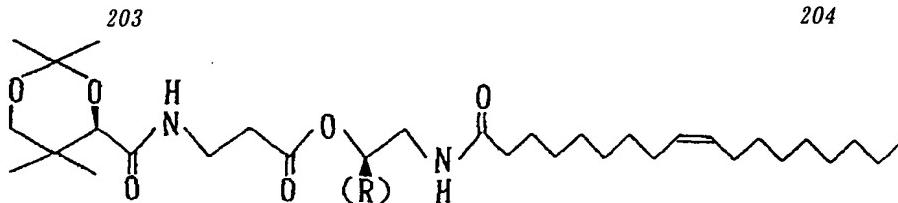
実施例1と同様にして以下の化合物を製造した。

#### 実施例81

化合物名：(R)-1-メチル-2-オレオイルアミノ  
エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオ  
キサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式：

(102)

分子式: C<sub>33</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 580.85

質量分析 計算値: 580.4451

実測値: 580.4448

融点(℃): oil

旋光度 [α]  $^{22}\text{D}$ ; +31.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3332, 2932, 2860, 1740, 1660

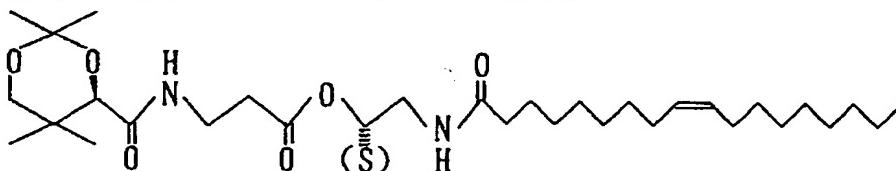
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.02 (3H, s),  
 1.21-1.38 (23H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),

\* 1.55-1.69 (2H, m), 1.91-2.08 (4H, m), 2.20  
 (2H, t, J=7Hz), 2.44-2.62 (2H, m), 3.29 (1H,  
 d, J=12Hz), 3.30-3.53 (3H, m), 3.65-3.78  
 (1H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.07 (3H, s),  
 4.92-5.03 (1H, m), 5.29-5.40 (2H, m), 6.30-  
 6.38 (1H, m), 6.91 (1H, t, J=6Hz)

## 実施例82

化合物名: (S)-1-メチル-2-オレオイルアミノエチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
構造式:

分子式: C<sub>33</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 580.85

質量分析 計算値: 580.4451

実測値: 580.4458

融点(℃): oil

旋光度 [α]  $^{23}\text{D}$ ; +21.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3332, 2932, 2860, 1738, 1662

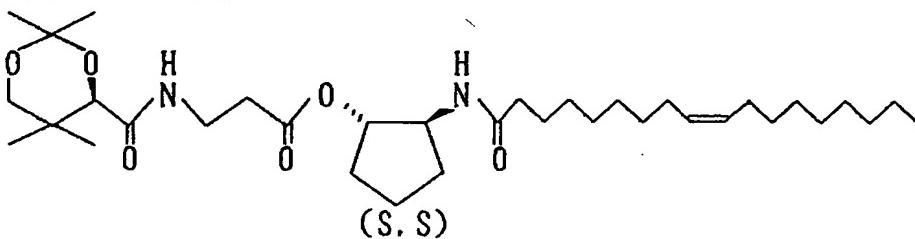
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.20-1.37 (23H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.56-1.68 (2H, m), 1.91-2.08 (4H, m), 2.20

\* (2H, t, J=7Hz), 2.44-2.62 (2H, m), 3.26-3.35  
 (1H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.42-3.58 (2H,  
 m), 3.64-3.75 (1H, m), 3.70 (1H, d, J=12Hz),  
 4.07 (1H, s), 4.93-5.03 (1H, m), 5.28-5.41 (2H,  
 m), 6.27-6.34 (1H, m), 6.88-6.96 (1H, m)

## 実施例83

化合物名: (1S, 2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
構造式:

分子式: C<sub>35</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 606.89

質量分析 計算値: 606.4607

実測値: 606.4617

融点(℃): oil

旋光度 [α]  $^{23}\text{D}$ ; +24.5° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3324, 2932, 2860, 1736, 1654

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

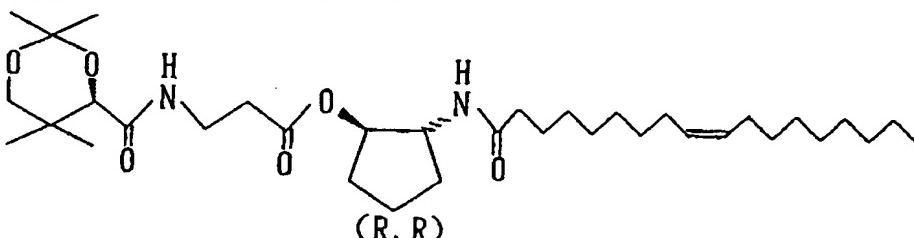
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.20-1.48 (22H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
 1.52-2.09 (9H, m), 2.13 (2H, t, J=7Hz), 2.18-  
 2.22 (1H, m), 2.54 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d,  
 J=12Hz), 3.48-3.59 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12  
 Hz), 4.08 (1H, s), 4.08-4.19 (1H, m), 4.92-  
 5.01 (1H, m), 5.29-5.40 (2H, m), 5.72 (1H, d,  
 J=7Hz), 6.98 (1H, t, J=6Hz)

## 50 実施例84

(103)

205

化合物名：(1R, 2R) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロペンタン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] \*

分子式: C<sub>35</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 606.89

質量分析 計算値: 606.4607

実測値: 606.4614

融点 (℃) : oil

旋光度 [α] <sup>24</sup>D; +14.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3328, 2932, 2860, 1740, 1656

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
1.21-1.47 (22H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
1.53-2.12 (9H, m), 2.13 (2H, t, J=7Hz), 2.18-

\* プロピオネート

構造式:

206

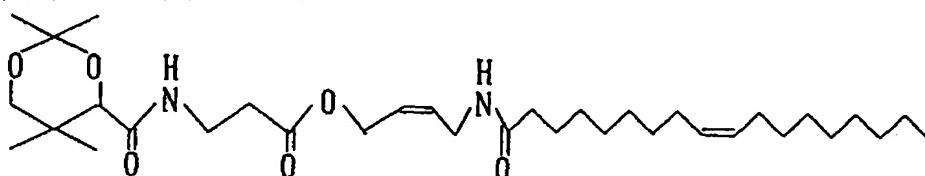
※ 2.31 (1H, m), 2.54 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.36-3.49 (1H, m), 3.58-3.69 (1H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.09-4.20 (1H, m), 4.95-5.02 (1H, m), 5.29-5.40 (2H, m), 5.72 (1H, d, J=7Hz), 7.02 (1H, t, J=6Hz)

実施例85

化合物名: 4-オレオイルアミノ- (Z) - 2 - プテニル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
構造式:

20

※

分子式: C<sub>34</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 592.80

質量分析 計算値: 592.4451

実測値: 592.4424

融点 (℃) : oil

旋光度 [α] <sup>24</sup>D; +22.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3336, 2932, 2860, 1740, 1660

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

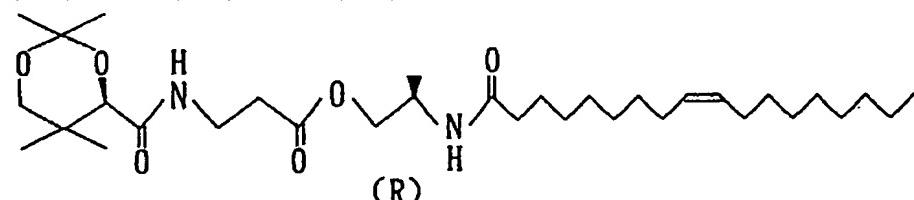
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.90 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
1.20-1.38 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s),

★ 1.54-1.69 (2H, m), 1.91-2.08 (4H, m), 2.17

2.20 (2H, t, J=7Hz), 2.57 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.42-3.67 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.97 (2H, dd, J=6Hz, 6Hz), 4.08 (1H, s), 4.70 (2H, d, J=6Hz), 5.29-5.40 (2H, m), 5.59-5.80 (3H, m), 6.88-6.96 (1H, m)

実施例86

化合物名: (2R) - 2 - メチル-2 - オレオイルアミノエチル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
構造式:

分子式: C<sub>33</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 580.85

質量分析 計算値: 580.4451

実測値: 580.4458

融点 (℃) : oil

旋光度 [α] <sup>25</sup>D; +31.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3324, 2932, 2860, 1740, 1660

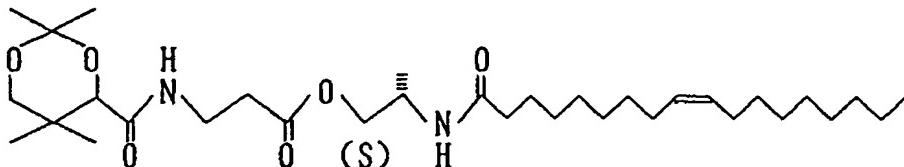
NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

50 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s),

(104)

207

1.18 (3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ) , 1.23-1.39 (20H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) , 1.57-1.68 (2H, m) ,  
 1.92-2.08 (4H, m) , 2.16 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.58 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.57 (2H, dt,  $J=6\text{Hz}, 6\text{Hz}$ ) , 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.03-4.14 (2H, m) , 4.07 (1H, s) , 4.26-4.37 (1H, m) , 5.29-5.40 (2H, m) , 5.84 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , \*

分子式: C<sub>33</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 580.85

質量分析 計算値: 580.4451

実測値: 580.4442

融点 (℃) : oil

旋光度 [α]  $^{24}\text{D}$ ; +13.1° (C = 1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2860, 1744, 1654

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 0.97 (3H, s) , 1.03 (3H, s) ,  
 1.16 (3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ) , 1.21-1.39 (20H, m) ,  
 1.42 (3H, s) , 1.47 (3H, s) , 1.54-1.68 (2H, m) ,

208

\* 6.98 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ )

実施例87

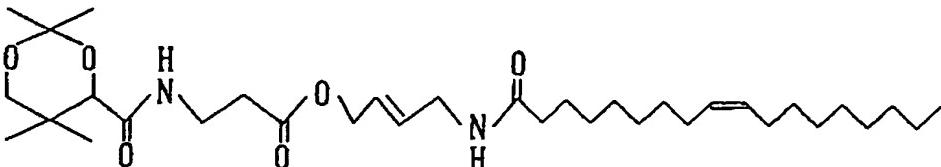
化合物名: (2S) - 2 - メチル - 2 - オレオイルアミノエチル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート  
構造式:

\* 1.92-2.08 (4H, m) , 2.17 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.58 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.49-3.67 (2H, m) , 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 4.05 (1H, dd,  $J=11\text{Hz}, 4\text{Hz}$ ) , 4.07 (1H, s) , 4.13 (1H, dd,  $J=11\text{Hz}, 5\text{Hz}$ ) , 4.22-4.36 (1H, m) , 5.29-5.42 (2H, m) , 5.92 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 6.92 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ )

20 実施例88

化合物名: 4 - オレオイルアミノ - (E) - 2 - プテニル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>34</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 592.86

質量分析 計算値: 592.4451

実測値: 592.4459

融点 (℃) : oil

旋光度 [α]  $^{24}\text{D}$ ; +22.1° (C = 1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3328, 2932, 2860, 1740, 1660

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

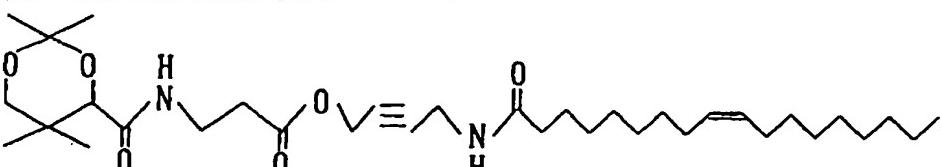
0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 0.96 (3H, s) , 1.04 (3H, s) ,  
 1.21-1.38 (20H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.46 (3H, s) ,  
 1.56-1.69 (2H, m) , 1.91-2.08 (4H, m) , 2.18

★ (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 2.58 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) , 3.28 (2H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.41-3.68 (2H, m) , 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.90 (2H, dd,  $J=6\text{Hz}, 6\text{Hz}$ ) , 4.08 (1H, s) , 4.57 (2H, d,  $J=6\text{Hz}$ ) , 5.28-5.41 (2H, m) , 5.52-5.62 (1H, m) , 5.65-5.83 (2H, m) , 6.95 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ )

実施例89

化合物名: 4 - オレオイルアミノ - 2 - プチニル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>34</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

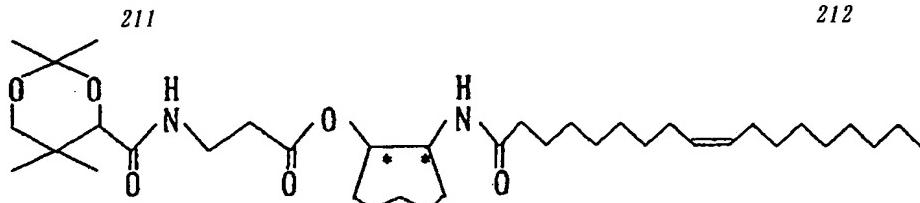
分子量: 590.85

質量分析 計算値: 590.4294

50 実測値: 590.4279



(106)

(-)-*trans*-2-aminocycloheptanol より分子式: C<sub>37</sub>H<sub>66</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 634.94

質量分析 計算値: 634.4920

実測値: 634.4911

融点 (℃) : oil

旋光度 [α] 26D; +22.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν neat, cm<sup>-1</sup>):

3328, 2932, 2864, 1734, 1660

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

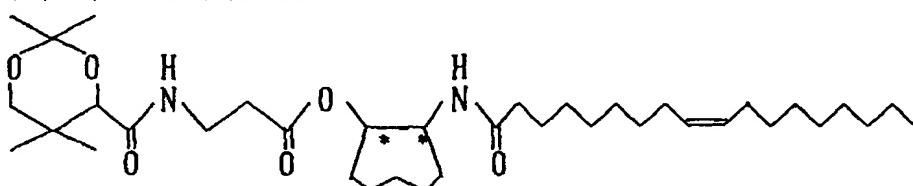
0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.00 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.21-1.38 (20H, m), 1.41-2.08 (16H, m), 1.43  
 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.09 (2H, t, J=7Hz),

\* 2.50 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.32  
 - 3.44 (1H, m), 3.57-3.68 (1H, m), 3.69 (1H,  
 10 d, J=12Hz), 3.99-4.09 (1H, m), 4.08 (1H, s),  
 4.77-4.84 (1H, m), 5.29-5.40 (2H, m), 5.82  
 (1H, d, J=8Hz), 6.97 (1H, t, J=6Hz)

## 実施例93

化合物名: (*trans*) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘプタン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

(+)-*trans*-2-aminocycloheptanol より分子式: C<sub>37</sub>H<sub>66</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 634.94

質量分析 計算値: 634.4920

実測値: 634.4904

融点 (℃) : oil

旋光度 [α] 26D; +13.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν neat, cm<sup>-1</sup>):

3324, 2932, 2864, 1734, 1650

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

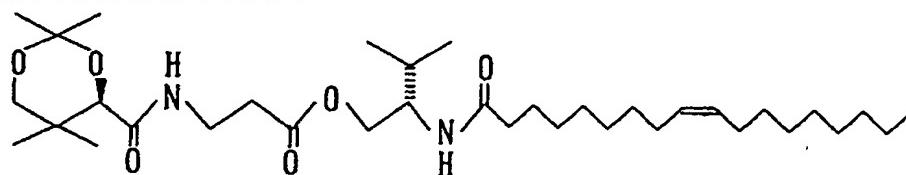
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.21-1.38 (20H, m), 1.40-2.08 (16H, m), 1.43

\* (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.10 (2H, t, J=7Hz),  
 2.50 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.51  
 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.69 (1H, d, J=12Hz),  
 3.97-4.08 (1H, m), 4.09 (1H, s), 4.77-4.84  
 (1H, m), 5.29-5.42 (2H, m), 5.89 (1H, d, J=8Hz),  
 6.92 (1H, t, J=6Hz)

## 実施例94

化合物名: (2S) - 3 - メチル - 2 - オレオイルアミノブチル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>35</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 608.91

質量分析 計算値: 608.4764

実測値: 608.4741

融点 (℃) : oil

旋光度 [α] 24D; +4.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν neat, cm<sup>-1</sup>):

3324, 2932, 2860, 1742, 1652

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

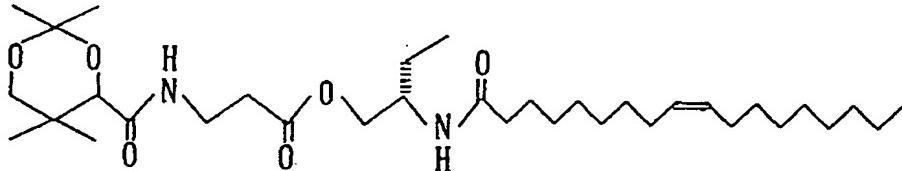
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.93 (3H, d, J=6Hz), 0.95  
 (3H, d, J=6Hz), 0.97 (3H, s), 1.07 (3H, s),  
 1.21-1.39 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.56-1.86 (3H, s), 1.90-2.08 (4H, m), 2.20  
 (2H, t, J=7Hz), 2.56 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H,

(107)

213

d, J=12Hz) , 3.56 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz) , 3.68  
 (1H, d, J=12Hz) , 3.95-4.29 (3H, m) , 4.07 (1H,  
 s) , 5.29-5.41 (2H, m) , 5.79 (1H, d, J=8Hz) ,  
 6.93 (1H, t, J=6Hz)

実施例95

分子式: C<sub>34</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 594.88

質量分析 計算値: 594.4607

実測値: 594.4597

融点(℃): oil

旋光度 [α] 25D; +6.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν neat, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2864, 1742, 1652

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.91 (3H, t, J=7Hz) , 0.97

(3H, s) , 1.03 (3H, s) , 1.21-1.38 (20H, m) ,

1.42 (3H, s) , 1.44-1.68 (4H, m) , 1.47 (3H, s) ,

214

\* 化合物名: (2S)-2-オレオイルアミノブチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
 構造式:

\*

※ 1.91-2.08 (4H, m) , 2.17 (2H, t, J=7Hz) , 2.58  
 (2H, t, J=6Hz) , 3.29 (1H, d, J=12Hz) , 3.57  
 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) ,  
 4.03-4.24 (3H, m) , 4.07 (1H, s) , 5.29-5.42  
 (2H, m) , 5.84 (1H, d, J=8Hz) , 6.92 (1H, t, J=6Hz)

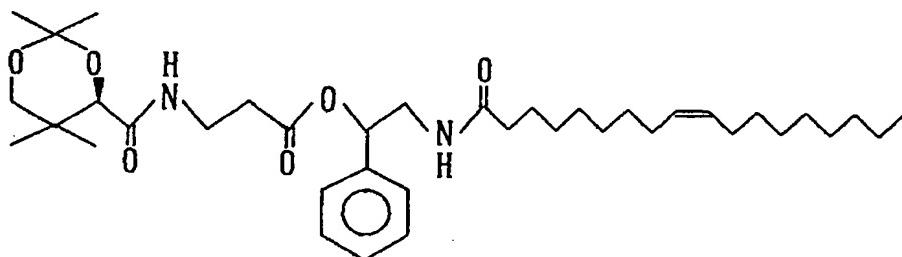
実施例96

化合物名: 2-オレオイルアミノ-1-フェニルエチル

20 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

※



diastereomer mix

1.92-2.08 (4H, m) , 2.12-2.22 (2H, m) , 2.48-2.67 (2H, m) , 3.26 (1/2H, d, J=12Hz) , 3.29 (1/2H, d, J=12Hz) , 3.42-3.85 (4H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) , 4.06 (1/2H, s) , 4.07 (1/2H, s) , 5.29-5.41 (2H, m) , 5.84 (1/2H, d, J=8Hz) , 5.86 (1/2H, d, J=8Hz) , 6.16-6.27 (1H, m) , 6.88-6.97 (1H, m) , 7.27-7.38 (5H, m)

40 実施例97

化合物名: (2S)-2-オレオイルアミノ-3-フェニルプロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
 構造式:

分子式: C<sub>38</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 642.92

質量分析 計算値: 642.4607

実測値: 642.4606

融点(℃): oil

旋光度 [α] 24D; +24.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν neat, cm<sup>-1</sup>):

3324, 2932, 2864, 1744, 1660

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.91 (3/2H, s) , 0.99

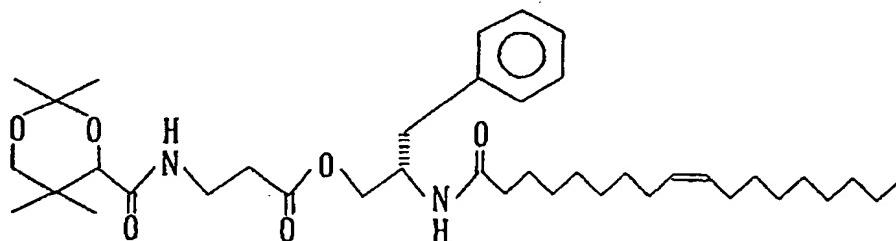
(3/2H, s) , 1.03 (3/2H, s) , 1.04 (3/2H, s) ,

1.19-1.38 (20H, m) , 1.41 (3/2H, s) , 1.42

(3/2H, s) , 1.43 (3H, s) , 1.52-1.66 (2H, m) ,

(108)

215

分子式: C<sub>39</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 656.95

質量分析 計算値: 656.4764

実測値: 656.4740

融点(℃): oil

旋光度 [α]  $^{25}\text{D}$ ; +18.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3316, 2932, 2860, 1742, 1660

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

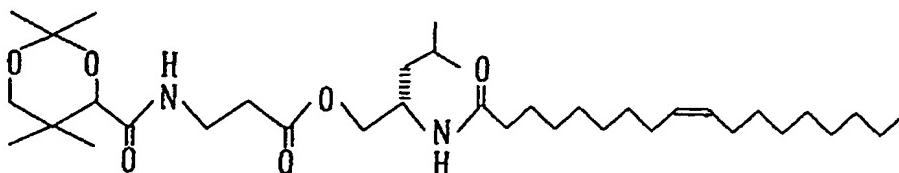
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
1.17-1.38 (20H, m), 1.41 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
1.50-1.68 (2H, m), 1.92-2.08 (4H, m), 2.16

\* (2H, t, J=7Hz), 2.59 (2H, t, J=6Hz), 2.78 (1H,  
dd, J=13Hz, 6Hz), 2.89 (1H, dd, J=13Hz, 7Hz),  
3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.39-3.69 (2H, m), 3.69  
(1H, d, J=12Hz), 4.04-4.09 (2H, m), 4.08 (1H,  
s), 4.37-4.47 (1H, m), 5.28-5.41 (2H, m),  
6.07 (1H, d, J=8Hz), 6.93 (1H, t, J=5Hz), 7.16  
- 7.32 (5H, m)

## 実施例98

化合物名: (2S)-4-メチル-2-オレオイルアミノ  
ペンチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-  
ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>36</sub>H<sub>66</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 622.93

質量分析 計算値: 622.4920

実測値: 622.4895

融点(℃): oil

旋光度 [α]  $^{25}\text{D}$ ; +7.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2864, 1742, 1652

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

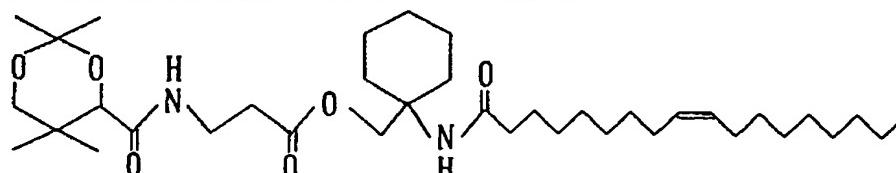
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.91 (3H, t, J=6Hz), 0.93  
(3H, t, J=6Hz), 0.97 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
1.19-1.41 (20H, m), 1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s),

\* 1.53-1.77 (5H, m), 1.90-2.08 (4H, m), 2.17  
(2H, t, J=7Hz), 2.57 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H,  
d, J=12Hz), 3.56 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.68  
(1H, d, J=12Hz), 4.07 (1H, s), 4.07 (1H, dd, J=  
11Hz, 4Hz), 4.13 (1H, dd, J=11Hz, 4Hz), 4.21-  
4.35 (1H, m), 5.28-5.41 (2H, m), 5.72 (1H, d,  
J=8Hz), 6.94 (1H, t, J=6Hz)

## 実施例99

化合物名: 2-オレオイルアミノ-2,2-ペンタメチレン  
エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジ  
オキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>37</sub>H<sub>66</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 634.94

質量分析 計算値: 634.4920

実測値: 634.4899

融点(℃): oil

旋光度 [α]  $^{29}\text{D}$ ; +22.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3352, 2936, 2864, 1742, 1664

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

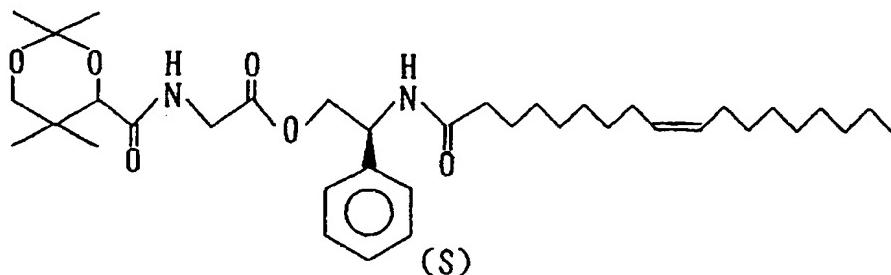
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
1.21-1.67 (32H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
1.91-2.13 (4H, m), 2.15 (2H, t, J=7Hz), 2.56  
(2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.46-  
3.63 (2H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.07 (1H,

(109)

217

s), 4.31 (1H, d, J=11Hz), 4.36 (1H, d, J=11Hz),  
5.13 (1H, s), 5.28-5.42 (2H, m), 6.96 (1H, t,  
J=5Hz)

## 実施例100

分子式: C<sub>37</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 628.90

質量分析 計算値: 628.4451

実測値: 628.4440

融点(℃): oil

旋光度 [α] 29D; +46.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν neat, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2864, 1760, 1662

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.04 (6H, s), 1.19-1.38  
(20H, m), 1.43 (3H, s), 1.48 (3H, s), 1.51-

\* 化合物名: (2S)-2-オレオイルアミノ-2-フェニルエチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]アセテート

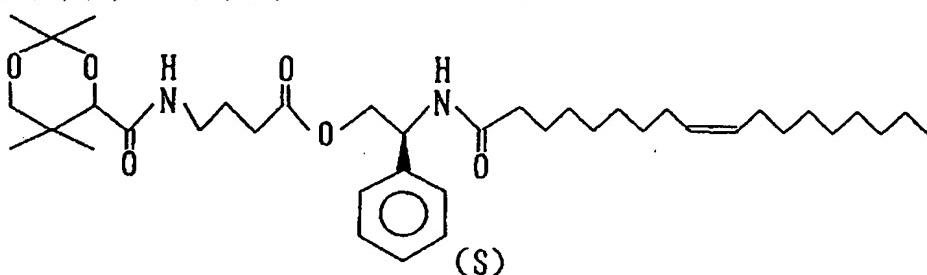
\* 構造式:

※ 1.69 (2H, m), 1.91-2.05 (4H, m), 2.24 (2H, t, J=7Hz), 3.30 (1H, d, J=12Hz), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.98 (2H, d, J=5Hz), 4.09 (1H, s), 4.39 (1H, dd, J=11Hz, 6Hz), 4.56 (1H, dd, J=11Hz, 5Hz), 5.28-5.40 (3H, m), 6.25 (1H, d, J=8Hz), 7.00 (1H, t, J=5Hz), 7.26-7.39 (5H, m)

## 実施例101

20 化合物名: (2S)-2-オレオイルアミノ-2-フェニルエチル 4-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]ブタノエート

\* 構造式:

分子式: C<sub>39</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 656.95

質量分析 計算値: 656.4764

実測値: 656.4770

融点(℃): oil

旋光度 [α] 30D; +41.4° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν neat, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2864, 1744, 1654

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

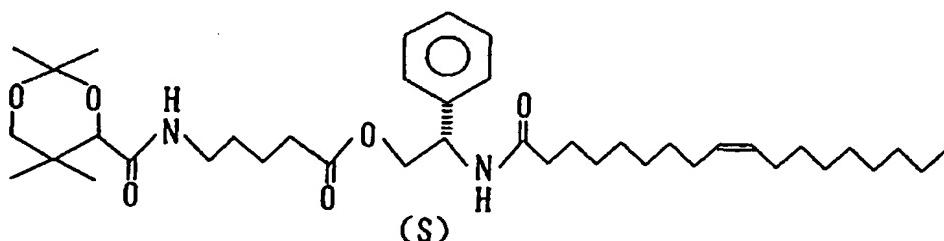
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.06 (3H, s), 1.21-1.38 (20H, m), 1.44 (3H, s), 1.48 (3H, s),

★ 1.56-2.07 (8H, m), 2.26 (2H, t, J=7Hz), 2.32 (2H, t, J=6Hz), 3.16-3.38 (2H, m), 3.30 (1H, d, J=12Hz), 3.70 (1H, d, J=12Hz), 4.09 (1H, s), 4.38 (1H, dd, J=11Hz, 6Hz), 4.44 (1H, dd, J=11Hz, 5Hz), 5.28-5.42 (3H, m), 6.64 (1H, t, J=5Hz), 6.76 (1H, d, J=8Hz), 7.26-7.38 (5H, m)

## 実施例102

化合物名: (2S)-2-オレオイルアミノ-2-フェニルエチル 5-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]ペンタノエート

構造式:

分子式: C<sub>40</sub>H<sub>66</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 670.98

(110)

219

質量分析 計算値: 670.4920

実測値: 670.4912

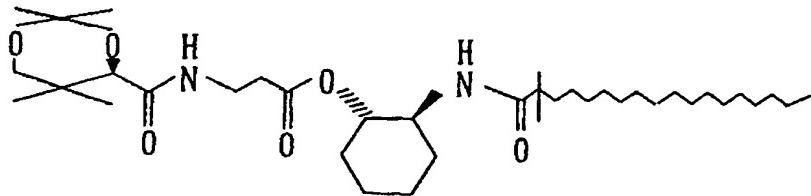
融点 (℃) : oil

旋光度 [α]  $^{20}\text{D}$ ; +40.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3324, 2932, 2864, 1742, 1654

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.05 (3H, s),  
 1.20-1.38 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.47-1.70 (6H, m), 1.92-2.08 (4H, m), 2.22  
 (2H, t, J=7Hz), 2.33 (2H, t, J=6Hz), 3.12-

分子式: C<sub>38</sub>H<sub>70</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 650.99

質量分析 計算値: 650.5233

実測値: 650.5244

融点 (℃) : oil

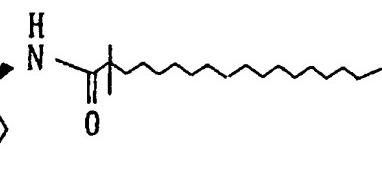
旋光度 [α]  $^{28}\text{D}$ ; +10.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3380, 2932, 2860, 1734

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.09 (6H, s), 1.10-2.16 (38H, m), 1.43 (3H, s),

\* 構造式:

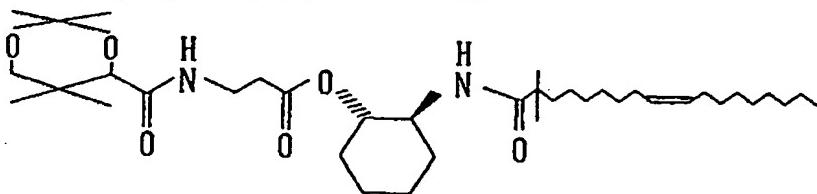


\* 1.47 (3H, s), 2.42-2.62 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.39-3.63 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.81-3.93 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.73 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.80 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=5Hz)

実施例104

化合物名: (1S, 2S)-2-(2,2-ジメチルオレオイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>38</sub>H<sub>68</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 648.97

質量分析 計算値: 648.5077

実測値: 648.5063

融点 (℃) : oil

旋光度 [α]  $^{28}\text{D}$ ; +10.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3380, 2936, 2864, 1734, 1672

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.00-2.18  
 (34H, m), 1.03 (3H, s), 1.08 (6H, s), 1.42  
 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.41-2.62 (2H, m),

3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.38-3.62 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.80-3.92 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.73 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.28-5.41 (2H, m), 5.79 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=5Hz)

\* 実施例105

化合物名: (1S, 2S)-2-(2-メチルオレオイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

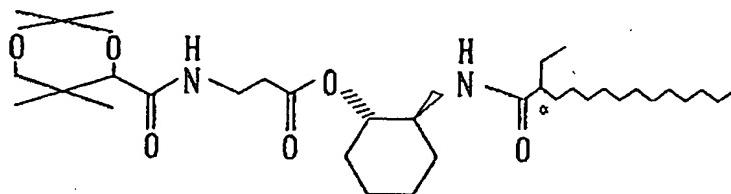
構造式:



(112)

223

ル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, \*ル) アミノ] プロピオネート  
2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ\* 構造式:

分子式: C<sub>34</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 594.88

質量分析 計算値: 594.4607

実測値: 594.4621

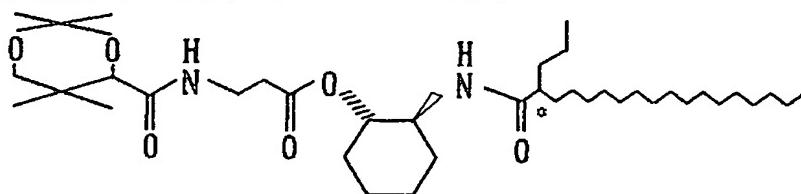
融点(℃): oil

旋光度 [α] <sup>19</sup>D; +10.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2936, 2864, 1734, 1648

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.85 (3H, t, J=7Hz), 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96  
(3H, s), 1.04 (3H, s), 1.10-2.23 (33H, m),

分子式: C<sub>39</sub>H<sub>72</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 665.01

質量分析 計算値: 664.5390

実測値: 664.5395

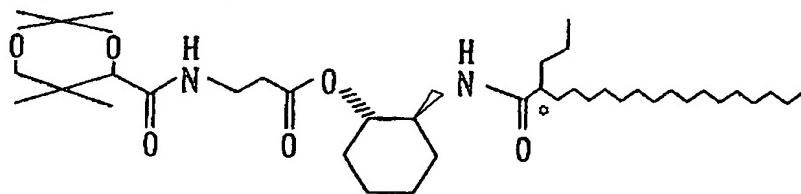
融点(℃): カラメル

旋光度 [α] <sup>19</sup>D; +9.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν, cm<sup>-1</sup>):

3288, 2932, 2860, 1730, 1670, 1644

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96  
(3H, s), 1.04 (3H, s), 1.12-2.23 (43H, m),

分子式: C<sub>39</sub>H<sub>72</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 665.01

質量分析 計算値: 664.5390

実測値: 664.5390

融点(℃): 103~105°C (ベンゼン/ヘキサン)

旋光度 [α] <sup>20</sup>D; +8.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν, KBr, cm<sup>-1</sup>):

3288, 2928, 2860, 1730, 1666, 1644

(112)

224

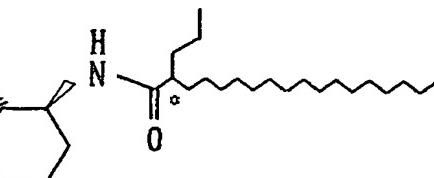
\*ル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, \*ル) アミノ] プロピオネート  
構造式:

※ 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.42-2.59 (2H, m),  
3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.51 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz),  
3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.82-3.95 (1H, m), 4.08  
(1H, s), 4.68 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),  
5.85 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=6Hz)

実施例109

化合物名: (1S, 2S)-2-(2-プロピルステアロイ  
ル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,  
2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
ル) アミノ] プロピオネート

構造式:

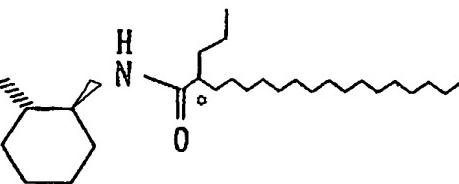


☆ 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.42-2.58 (2H, m),  
3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.51 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz),  
3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.83-3.95 (1H, m), 4.08  
(1H, s), 4.68 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),  
5.82 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=6Hz)

実施例111

化合物名: (1S, 2S)-2-(2-プロピルステアロイ  
ル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,  
2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
ル) アミノ] プロピオネート

構造式:

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

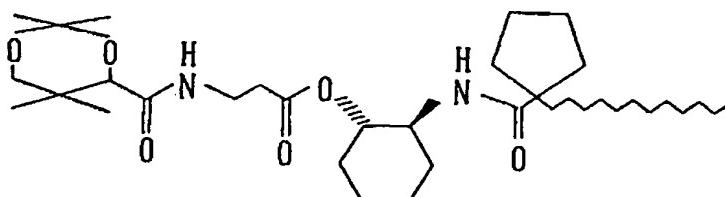
0.86 (3H, t, J=7Hz), 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96  
(3H, s), 1.04 (3H, s), 1.11-2.21 (43H, m),  
1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.41-2.60 (2H, m),  
3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.51 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz),  
3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.83-3.97 (1H, m), 4.08  
(1H, s), 4.68 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),  
5.77 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=6Hz)

(113)

225

## 実施例112

化合物名：(1S,2S)-2-(1-ドデシルシクロペン  
タンカルボニル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3\*

分子式: C<sub>36</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 620.92

質量分析 計算値: 620.4764

実測値: 620.4775

融点(℃): oil

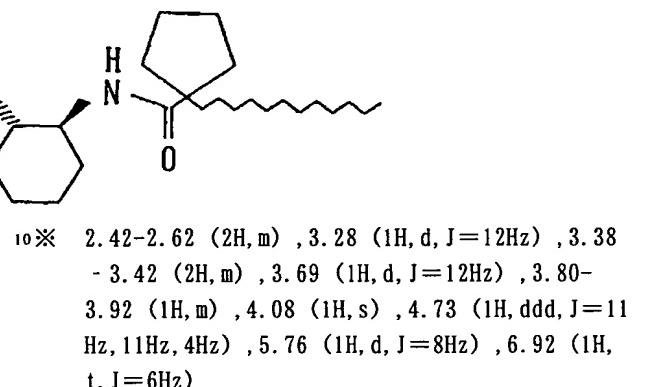
旋光度 [α] <sup>22</sup>D; +9.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν neat, cm<sup>-1</sup>):

3360, 2932, 2864, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
1.11-2.18 (38H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),

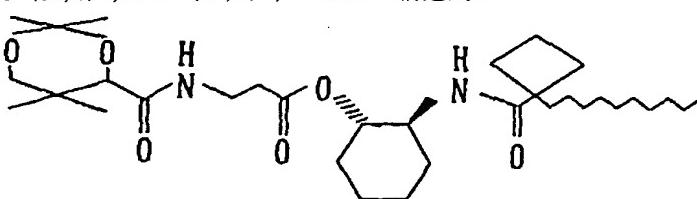
\* - [(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-  
カルボニル)アミノ]プロピオネート  
構造式:



## 実施例113

化合物名: (1S,2S)-2-(1-デシルシクロブタン  
カルボニル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-  
[(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カ  
ルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>33</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 578.84

質量分析 計算値: 578.4294

実測値: 578.4285

融点(℃): oil

旋光度 [α] <sup>22</sup>D; +8.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν neat, cm<sup>-1</sup>):

3336, 2936, 2864, 1734

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

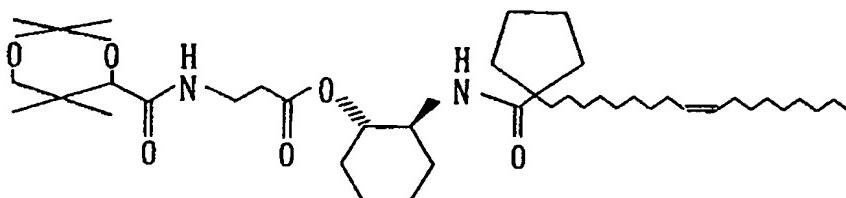
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
1.06-1.40 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),

★ 1.57-2.34 (12H, m), 2.43-2.62 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.41-3.62 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.81-3.94 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.71 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 5Hz), 5.59 (1H, d, J=8Hz), 7.92 (1H, t, J=5Hz)

## 実施例114

化合物名: (1S,2S)-2-(1-9-オクタデセニル  
シクロヘキサンカルボニル)アミノシクロヘキサン-1-  
イル 3-[(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジ  
オキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>42</sub>H<sub>74</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 701.05

質量分析 計算値: 702.5546

実測値: 702.5570

融点(℃): oil

旋光度 [α] <sup>22</sup>D; +8.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν neat, cm<sup>-1</sup>):

3368, 2932, 2864, 1734

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
1.09-2.17 (46H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
2.41-2.61 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.37-3.62 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.81-3.93 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.73 (1H, ddd,

50

(114)

227

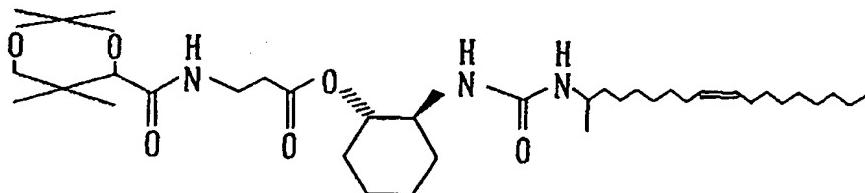
$J = 11\text{Hz}, 11\text{Hz}, 4\text{Hz}$ , 5.28-5.40 (2H, m), 5.75  
(1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.93 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ )

実施例115

化合物名：(1S, 2S)-2-[[(1-メチル-8-ヘプト-1-エノイル)アミノ]カルバモイル]アミノシクロヘキサン-1-イル

228

\*タデセニル)カルバモイル]アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
構造式：



diastereomeric mixture

分子式: C<sub>37</sub>H<sub>67</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 649.96

質量分析 計算値: 649.5029

実測値: 649.5029

融点(℃): oil

旋光度 [α]<sub>D</sub>: +19.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$ , neat, cm<sup>-1</sup>):

3360, 2936, 2864, 1734, 1682, 1644

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),1.08 (3/2H, d,  $J=6\text{Hz}$ ), 1.09 (3/2H, d,  $J=6\text{Hz}$ ),

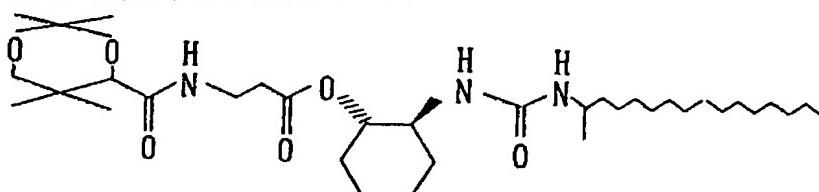
1.14-1.50 (24H, m), 1.44 (3H, s), 1.47 (3H, s),

※ 1.52-2.26 (11H, m), 2.37-2.59 (2H, m), 3.28  
- 3.46 (1H, m), 3.58-3.80 (3H, m), 3.69 (1H, d,  
 $J=12\text{Hz}$ ), 4.10 (1H, s), 4.55 (1H, ddd,  $J=11\text{Hz}$ ,  
11Hz, 4Hz), 5.28-5.42 (2H, m), 6.86-6.96  
(1H, m)

実施例116

化合物名：(1S, 2S)-2-[[(1-メチルヘプタデシル)カルバモイル]アミノシクロヘキサン-1-イル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式：

分子式: C<sub>35</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 623.92

質量分析 計算値: 623.4873

実測値: 623.4852

融点(℃): oil

旋光度 [α]<sub>D</sub>: +20.5° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$ , KBr, cm<sup>-1</sup>):

3360, 2932, 2860, 1738, 1682, 1642

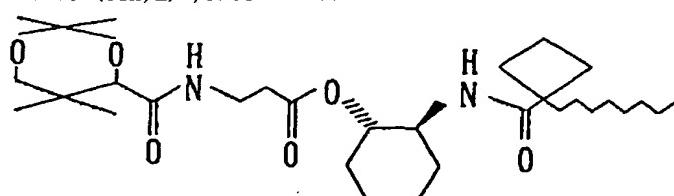
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),1.08 (3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ), 1.12-1.78 (32H, m), 1.44

★ (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.94-2.58 (4H, m),  
3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.34-3.79 (4H, m), 3.69  
(1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 4.10 (1H, s), 4.55 (1H, ddd,  
 $J=11\text{Hz}, 11\text{Hz}, 4\text{Hz}$ ), 6.92 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ )

実施例117

化合物名：(1S, 2S)-2-[(1-オクチルシクロブタノカルボニル)アミノシクロヘキサン-1-イル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式：

分子式: C<sub>31</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 550.78

質量分析 計算値: 550.3981

実測値: 550.4005

融点(℃): oil

50 旋光度 [α]<sub>D</sub>: +13.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

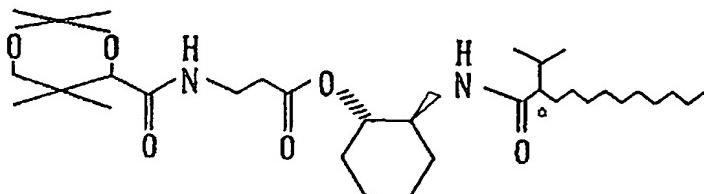
(115)

229

IR ( $\nu$  neat,  $\text{cm}^{-1}$ ) :  
3336, 2932, 2860, 1732

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 0.96 (3H, s) , 1.04 (3H, s) ,  
1.06-1.58 (16H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) ,  
1.60-2.36 (12H, m) , 2.43-2.63 (2H, m) ,  
3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.39-3.63 (2H, m) , 3.69  
(1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.81-3.94 (1H, m) , 4.08 (1H,

分子式:  $\text{C}_{33}\text{H}_{60}\text{N}_2\text{O}_6$ 

分子量: 580.85

質量分析 計算値: 580.4451

実測値: 580.4435

融点 (°C) : wax

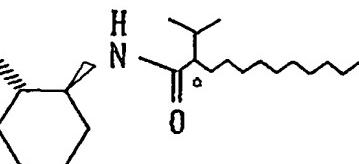
旋光度 [ $\alpha$ ]  $27\text{D}$ ; +11.9° (C=1.0,  $\text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu$  KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3288, 2932, 2860, 1730

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 0.88 (3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ) , 0.91  
(3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ) , 0.96 (3H, s) , 1.04 (3H, s) ,  
1.00-1.82 (26H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) ,

\* 構造式:

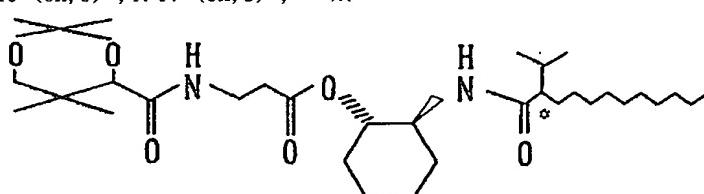


\* 1.93-2.04 (1H, m) , 2.15-2.26 (1H, m) , 2.41-  
2.58 (2H, m) , 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.42-3.60  
(2H, m) , 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.82-3.94 (1H,  
m) , 4.08 (1H, s) , 4.67 (1H, ddd,  $J=11\text{Hz}, 11\text{Hz},$   
 $4\text{Hz}$ ) , 5.87 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 6.91 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ )

20 実施例119

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2 - (2 - イソプロピルラウロイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $\text{C}_{33}\text{H}_{60}\text{N}_2\text{O}_6$ 

分子量: 580.85

質量分析 計算値: 580.4451

実測値: 580.4458

融点 (°C) : カラメル

旋光度 [ $\alpha$ ]  $30\text{D}$ ; +10.6° (C=1.0,  $\text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu$  KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3276, 2932, 2860, 1730

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

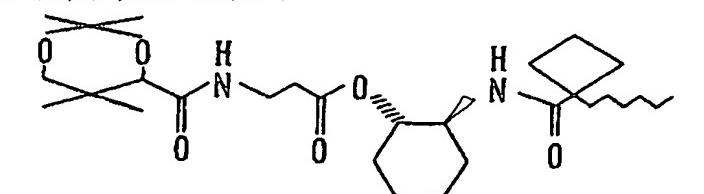
0.85 (3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ) , 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ) , 0.89  
(3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ) , 0.96 (3H, s) , 1.04 (3H, s) ,  
1.05-1.83 (26H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) ,

1.92-2.04 (1H, m) , 2.13-2.22 (1H, m) , 2.40-  
2.58 (2H, m) , 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.45-3.58  
(2H, m) , 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) , 3.85-3.97 (1H,  
m) , 4.08 (1H, s) , 4.68 (1H, ddd,  $J=11\text{Hz}, 11\text{Hz},$   
 $4\text{Hz}$ ) , 5.78 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) , 6.90 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ )

実施例120

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (1 - ヘキシリシクロブタ - 4 - カルボニル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:



(116)

231

分子式: C<sub>29</sub>H<sub>50</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 522.73

質量分析 計算値: 522.3668

実測値: 522.3668

融点(℃): oil

旋光度 [α] 30D; +13.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν, cm<sup>-1</sup>):

3336, 2936, 2864, 1732

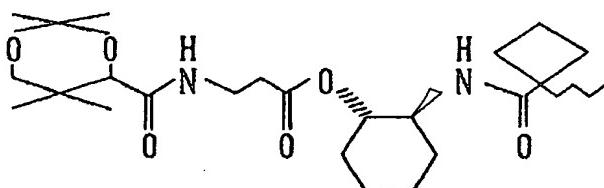
NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.05-1.58 (12H, m), 1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.61-2.34 (12H, m), 2.43-2.62 (2H, m), 3.28  
 (1H, d, J=12Hz), 3.41-3.62 (2H, m), 3.69 (1H,  
 d, J=12Hz), 3.82-3.93 (1H, m), 4.07 (1H, s),  
 4.71 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.60 (1H, d,  
 J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=5Hz)

## 実施例121

化合物名: (1S, 2S)-2-(1-ブチルシクロプロタンカルボニル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>30</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 538.77

質量分析 計算値: 538.3981

実測値: 538.3989

融点(℃): oil

旋光度 [α] 28D; +10.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν, cm<sup>-1</sup>):

2932, 2860, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.05 (3H, s),  
 1.06-1.44 (20H, m), 1.46-2.28 (12H, m), 2.44

(116)

232

分子式: C<sub>27</sub>H<sub>46</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 494.67

質量分析 計算値: 494.3355

実測値: 494.3366

融点(℃): カラメル

旋光度 [α] 30D; +15.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν, KBr, cm<sup>-1</sup>):

3348, 2940, 2868, 1732

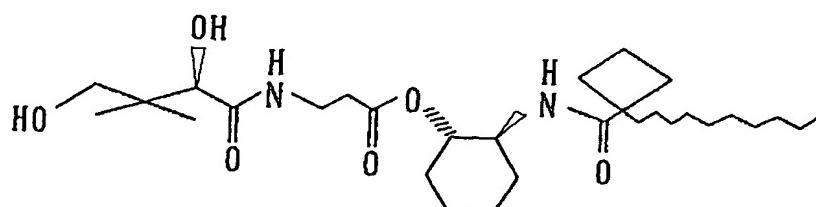
NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.05-1.58 (8H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.62-2.33 (12H, m), 2.44-2.61 (2H, m), 3.28  
 (1H, d, J=12Hz), 3.41-3.63 (2H, m), 3.69 (1H,  
 d, J=12Hz), 3.81-3.94 (1H, m), 4.08 (1H, s),  
 4.72 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.61 (1H, d,  
 J=8Hz), 6.93 (1H, t, J=5Hz)

## 実施例122

化合物名: (1S, 2S)-2-(1-デシルシクロプロタンカルボニル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 4-ジヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート

構造式:



- 2.64 (2H, m), 2.77 (2H, br-s), 3.46-3.68 (2H, m), 3.49 (1H, d, J=11Hz), 3.56 (1H, d, J=11Hz), 3.84-3.98 (1H, m), 4.05 (1H, s),  
 4.69 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.53 (1H, d,  
 J=9Hz), 7.37 (1H, t, J=5Hz)

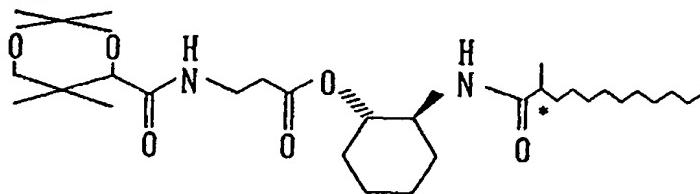
## 40 実施例123

化合物名: (1S, 2S)-2-(1-メチルラウロイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

(117)

233

分子式: C<sub>31</sub>H<sub>56</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 552.80

質量分析 計算値: 552.4138

実測値: 552.4127

融点(℃): oil

旋光度 [α] <sup>31</sup>D; +15.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν KBr, cm<sup>-1</sup>):

3304, 2932, 2860, 1738

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
 1.07 (3H, d, J=7Hz), 1.10-1.38 (20H, m), 1.42  
 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.48-2.19 (7H, m),

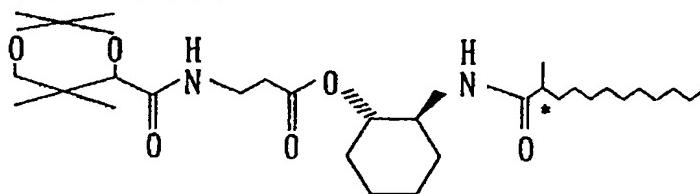
\*

\* 2.42-2.57 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.51  
 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.69 (1H, d, J=12Hz),  
 3.81-3.94 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.68 (1H, ddd,  
 J=4Hz), 5.76 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=6  
 Hz)

## 実施例124

化合物名: (1S, 2S)-2-(1-メチルラウロイル)  
 アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,  
 5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)  
 アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>31</sub>H<sub>56</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 552.80

質量分析 計算値: 552.4138

実測値: 552.4139

融点(℃): wax

旋光度 [α] <sup>31</sup>D; +7.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν KBr, cm<sup>-1</sup>):

3272, 2932, 2860, 1744

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.30 (3H, s),  
 1.06 (3H, d, J=7Hz), 1.10-1.39 (20H, m), 1.43  
 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.49-2.16 (7H, m),

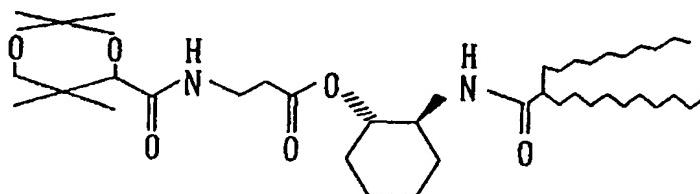
※

※ 2.50 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz),  
 3.51 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.69 (1H, d, J=12Hz),  
 3.82-3.96 (1H, m), 4.08 (1H, m), 4.67 (1H, ddd,  
 J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.73 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1  
 H, t, J=6Hz)

## 実施例125

化合物名: (1S, 2S)-2-(2-デシルラウロイル)  
 アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,  
 5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)  
 アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>40</sub>H<sub>74</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 679.04

質量分析 計算値: 678.5546

実測値: 678.5535

融点(℃): 70~71°C (ヘキサン)

旋光度 [α] <sup>28</sup>D; +10.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν KBr, cm<sup>-1</sup>):

3288, 2928, 2856, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

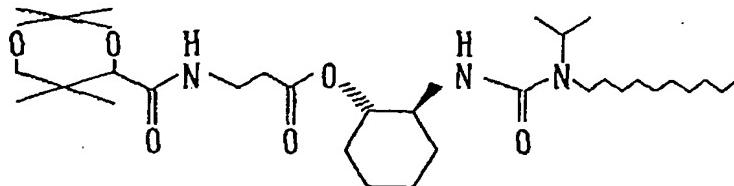
0.88 (6H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.08-2.22 (45H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 2.39-2.58 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz),  
 3.51 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.69 (1H, d, J=12Hz),  
 3.83-3.96 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.68 (1H, ddd,  
 J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.82 (1H, d, J=8Hz), 6.90  
 (1H, t, J=8Hz)

(118)

235

## 実施例126

化合物名：(1S, 2S) - 2 - (N-デシル-N-イソプロピルカルバモイル) アミノシクロヘキサン-1-イル\*

分子式: C<sub>32</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 581.84

質量分析 計算値: 581.4403

実測値: 581.4414

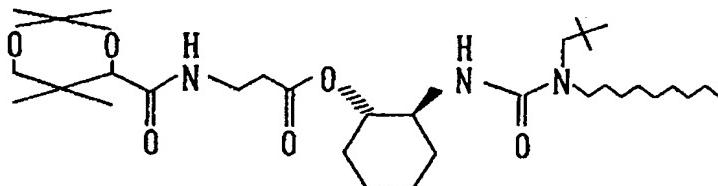
融点(℃): oil

旋光度 [α] 27D; +30.1° (C=0.5, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν neat, cm<sup>-1</sup>):

2932, 2860, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
1.10 (6H, d, J=7Hz), 1.15-2.21 (24H, m), 1.42  
(3H, s), 1.47 (3H, s), 2.47-2.62 (2H, m),

分子式: C<sub>33</sub>H<sub>61</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 595.87

質量分析 m/e 595 (M<sup>+</sup>)

融点(℃): 69.4~72.9°C (n-hexane)

IR (ν KBr, cm<sup>-1</sup>):

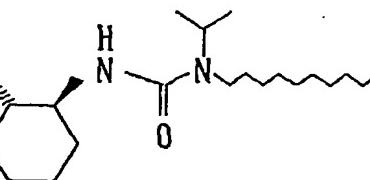
3388, 2932, 1730, 1670, 1618, 1378, 1098

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.91 (9H, s), 0.96 (9H, s),  
1.04 (3H, s), 1.05-2.21 (22H, m), 1.42 (3H, s),  
1.47 (3H, s), 2.43-2.62 (2H, m), 2.91 (1H, d,  
J=15Hz), 2.97-3.10 (1H, m), 3.05 (1H, d, J=  
15Hz), 3.16-3.27 (1H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz),  
3.37-3.64 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz),

236

\* 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
構造式:



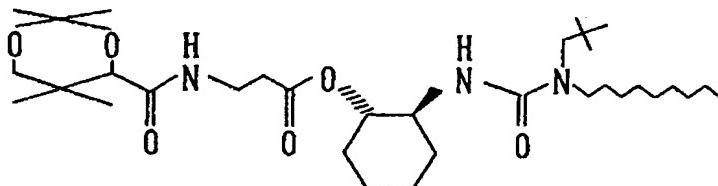
10※ 2.93 (2H, t, J=7Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz),  
3.34-3.64 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.74  
- 3.88 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.18-4.33 (1H, m),  
4.38-4.46 (1H, m), 4.71 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz,  
4Hz), 6.93 (1H, t, J=5Hz)

## 実施例127

化合物名: (1S, 2S) - 2 - [N - (2, 2-ジメチルプロピル) - N - ノニルカルバモイル] アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオ

20 ネート

※ 構造式:



★ 3.71-3.86 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.52 (1H, d,  
J=8Hz), 4.70 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),  
6.92 (1H, t, J=5Hz)

元素分析

計算値: C, 66.52 H, 10.32 N, 7.05

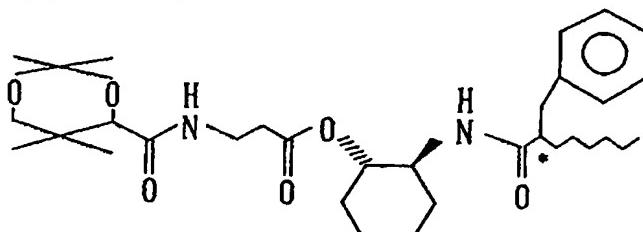
実測値: C, 66.26 H, 10.55 N, 7.30

## 実施例128

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-フェニルメチルカブリロイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

★ 40



実測値: 572.3841

融点(℃): カラメル

50 旋光度 [α] 21D; -5.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)分子式: C<sub>33</sub>H<sub>52</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 572.79

質量分析 計算値: 572.3825

(119)

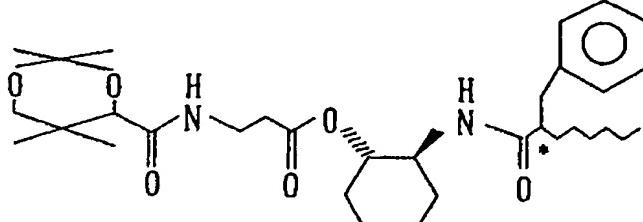
237

IR ( $\nu$  KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3304, 2936, 2864, 1734, 1662, 1646

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.87 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
 1.05-1.95 (18H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
 2.09-2.24 (1H, m), 2.37-2.54 (2H, m), 2.68  
 (2H, dd,  $J=13\text{Hz}, 5\text{Hz}$ ), 2.83 (1H, dd,  $J=13\text{Hz},$   
 10Hz), 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.48 (2H, dt,  
 $J=6\text{Hz}, 6\text{Hz}$ ), 3.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.70-

分子式:  $\text{C}_{33}\text{H}_{52}\text{N}_2\text{O}_6$ 

分子量: 572.79

質量分析 計算値: 572.3825

実測値: 572.3812

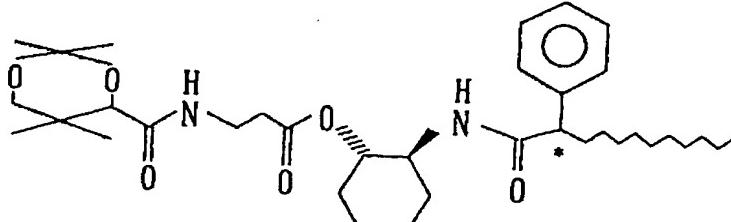
融点(℃) : カラメル

旋光度 [ $\alpha$ ]  $^{21}\text{D}$ ; +26.1° (C=1.0,  $\text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu$  KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3320, 2940, 2864, 1734, 1652

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.87 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
 1.05-1.47 (12H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.51-2.31 (9H, m), 2.61 (1H, dd,  $J=14\text{Hz}, 5\text{Hz}$ ),      \*

分子式:  $\text{C}_{36}\text{H}_{58}\text{N}_2\text{O}_6$ 

分子量: 614.87

質量分析 計算値: 614.4294

実測値: 614.4310

融点(℃) : oil

旋光度 [ $\alpha$ ]  $^{30}\text{D}$ ; +14.8° (C=0.9,  $\text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu$  neat,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3312, 2932, 2860, 1734

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.87 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.97 (3H, s), 1.05 (3H, s),  
 1.11-1.39 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.48 (3H, s),  
 1.52-2.11 (6H, m), 2.32-2.51 (2H, m), 3.25

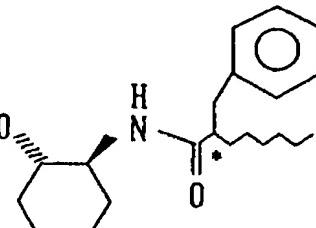
238

\* 3.82 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.50 (1H, ddd,  
 $J=11\text{Hz}, 11\text{Hz}, 4\text{Hz}$ ), 5.42 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ),  
 6.88 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ ), 7.12-7.26 (5H, m)

実施例129

化合物名: (1S, 2S)-2-(2-フェニルメチルカブリロイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

\* 構造式:

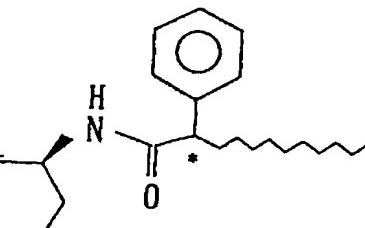


\* 2.94 (1H, dd,  $J=14\text{Hz}, 9\text{Hz}$ ), 3.22-3.28 (2H, m),  
 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ),  
 3.70-3.84 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.55 (1H,  
 20 ddd,  $J=11\text{Hz}, 11\text{Hz}, 5\text{Hz}$ ), 5.93 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ),  
 6.81 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ ), 7.12-7.30 (5H, m)

実施例130

化合物名: (1S, 2S)-2-(2-フェニルラウロイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:



(1H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 3.29 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.38-  
 3.56 (2H, m), 3.70 (1H, d, 12Hz), 3.77-3.89  
 (1H, m), 4.09 (1H, s), 4.59 (1H, ddd,  $J=11\text{Hz},$   
 11Hz, 4Hz), 5.68 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.89 (1H, t,  
 40  $J=5\text{Hz}$ ), 7.21-7.36 (5H, m)

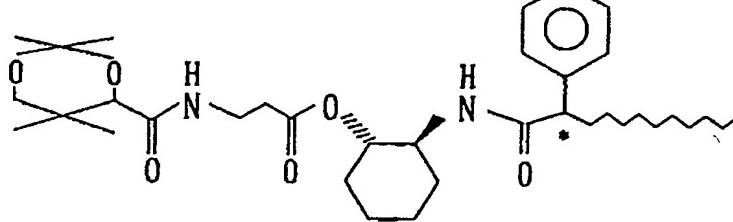
実施例131

化合物名: (1S, 2S)-2-(2-フェニルラウロイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

(120)

239

分子式: C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 614.87

質量分析 計算値: 614.4294

実測値: 614.4311

融点 (℃) : wax

旋光度 [α] 30D; +34.4° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν KBr, cm<sup>-1</sup>):

3308, 2932, 2864, 1730

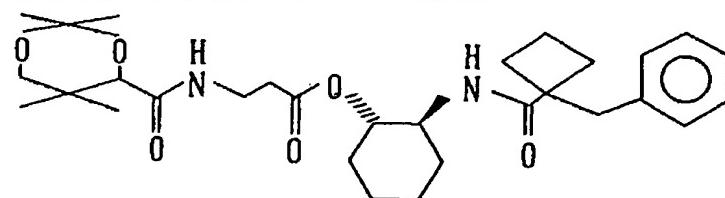
NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.94 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
1.09-1.42 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.48 (3H, s), \*

\* 1.52-2.15 (8H, m), 3.20-3.21 (3H, m), 3.28  
(1H, d, J=12Hz), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 3.76  
10 - 3.89 (1H, m), 4.06 (1H, s), 4.59 (1H, ddd,  
J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.75 (1H, d, J=8Hz), 6.71  
(1H, t, J=5Hz), 7.19-7.34 (5H, m)

実施例132

化合物名: (1S, 2S)-2-(1-ベンジルシクロブタンカルボニル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>30</sub>H<sub>44</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 528.69

質量分析 計算値: 528.3199

実測値: 528.3193

融点 (℃) : カラメル

旋光度 [α] 30D; +11.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν KBr, cm<sup>-1</sup>):

3356, 2944, 2868, 1732

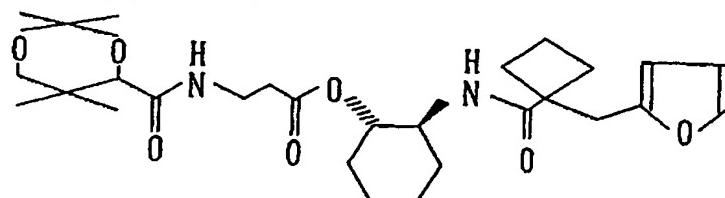
NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):0.84-1.55 (4H, m), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.58-2.67 (12H, m),  
3.00 (1H, d, J=14Hz), 3.03 (1H, d, J=14Hz), \*

※ 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.27-3.52 (2H, m), 3.68  
(1H, d, J=12Hz), 3.72-3.87 (1H, m), 4.06 (1H,  
s), 4.59 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 4.51  
1H, d, J=8Hz), 6.88 (1H, t, J=5Hz), 7.11-  
7.28 (5H, m)

30 実施例133

化合物名: (1S, 2S)-2-(1-フルフリルシクロブタンカルボニル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>28</sub>H<sub>42</sub>N<sub>2</sub>O<sub>7</sub>

分子量: 518.65

質量分析 計算値: 518.2992

実測値: 518.2969

融点 (℃) : oil

旋光度 [α] 30D; +12.8° (C=0.5, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν KBr, cm<sup>-1</sup>):

3352, 2944, 2868, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):  
0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.18-2.57 (16H, m),  
1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s), 3.03 (2H, s),  
3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.33-3.58 (2H, m),  
3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.67-3.90 (1H, m),  
4.07 (1H, s), 4.63 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),  
5.49 (1H, d, J=8Hz), 6.03 (1H, d, J=3Hz),  
6.26 (1H, dd, J=3Hz, 1Hz), 6.92 (1H, t, J=5Hz),

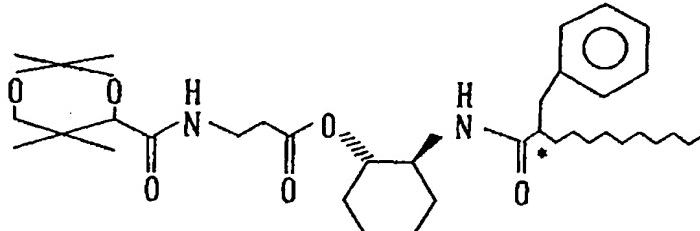
(121)

241

7.29 (1H, d, J=1Hz)

## 実施例134

化合物名：(1S, 2S) - 2 - (2 - ベンジルラウロイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, \*

分子式: C<sub>37</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 628.90

質量分析 計算値: 628.4451

実測値: 628.4442

融点 (℃) : wax

旋光度 [α] 29D; -5.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2860, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.62-1.50 (20H, m), 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.52-2.30 (7H, m), 2.38-2.55 (2H, m),

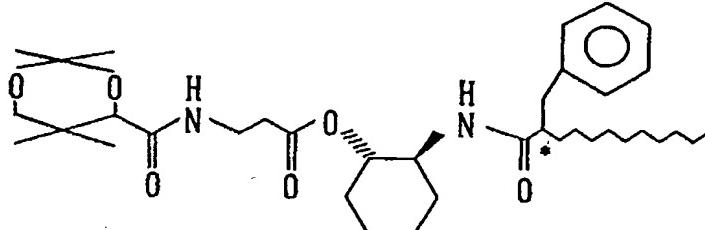
※ 2.68 (1H, dd, J=15Hz, 6Hz), 2.83 (1H, dd, J=15Hz, 10Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.48 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 3.70-3.83 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.50 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 5Hz), 5.91 (1H, d, J=8Hz), 6.88 (1H, t, J=6Hz), 7.11-7.27 (5H, m)

## 実施例135

化合物名：(1S, 2S) - 2 - (1 - ベンジルラウロイル)

20 ル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>37</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 628.90

質量分析 計算値: 628.4451

実測値: 628.4478

融点 (℃) : wax

旋光度 [α] 27D; +26.7° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν KBr, cm<sup>-1</sup>):

3300, 2932, 2860, 1734

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

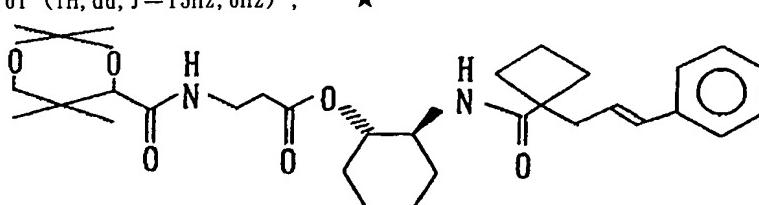
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.06-1.50 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.52-2.30 (9H, m), 2.61 (1H, dd, J=15Hz, 6Hz),

★ 2.93 (1H, dd, J=15Hz, 10Hz), 3.20-3.30 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.71-3.83 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.55 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.91 (1H, d, J=7Hz), 6.81 (1H, t, J=5Hz), 7.13-7.28 (5H, m)

## 実施例136

化合物名：(1S, 2S) - 2 - (1 - シンナミルシクロプロパンカルボニル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>32</sub>H<sub>46</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 554.73

質量分析 計算値: 554.3355

実測値: 554.3361

(122)

243

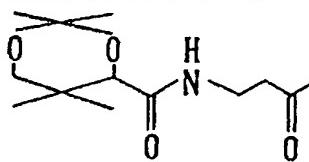
融点(℃) : カラメル

旋光度  $[\alpha]^{29D} +14.9^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu_{\text{KBr}}$ ,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3340, 2944, 2868, 1732

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.89-1.57 (4H, m), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
 1.41 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.58-2.67 (12H, m),  
 2.59 (2H, d,  $J=7\text{Hz}$ ), 3.27 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ),  
 3.32-3.63 (2H, m), 3.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.82  
 - 3.95 (1H, m), 4.06 (1H, s), 4.68 (1H, ddd,  $J=$

分子式:  $\text{C}_{32}\text{H}_{48}\text{N}_2\text{O}_6$ 

分子量: 556.74

質量分析 計算値: 556.3512

実測値: 556.3516

融点(℃) : カラメル

旋光度  $[\alpha]^{29D} +12.5^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu_{\text{KBr}}$ ,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3352, 2940, 2868, 1732

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.95 (3H, s), 0.95-1.56 (6H, m), 1.03 (3H, s),  
 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.62-2.48 (14H, m),

(122)

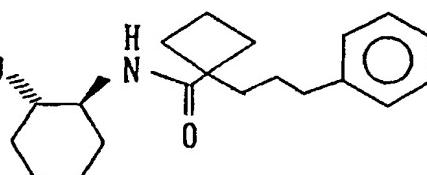
244

\* 11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.68 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.08  
 (1H, dt,  $J=16\text{Hz}, 7\text{Hz}$ ), 6.44 (1H, d,  $J=16\text{Hz}$ ),  
 6.88 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ ), 7.17-7.38 (5H, m)

実施例137

化合物名: (1S, 2S)-2-[1-(3-フェニルプロピル)シクロブタンカルボニル]アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

\* 10 構造式:

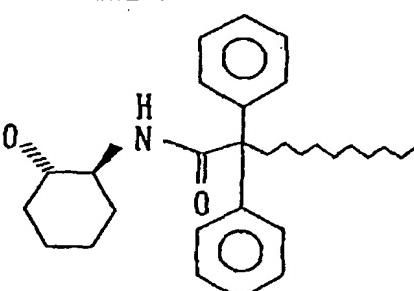


\* 2.51-2.66 (2H, m), 3.27 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.28  
 - 3.48 (2H, m), 3.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.79-  
 3.92 (1H, m), 4.06 (1H, s), 4.67 (1H, ddd,  $J=$   
 20 11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.64 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.86  
 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ ), 7.12-7.30 (5H, m)

実施例138

化合物名: (1S, 2S)-2-(2, 2-ジフェニルラウロイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式:  $\text{C}_{42}\text{H}_{62}\text{N}_2\text{O}_6$ 

分子量: 690.97

質量分析 計算値: 690.4607

実測値: 690.4604

融点(℃) : oil

旋光度  $[\alpha]^{29D} +18.8^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu_{\text{neat}}$ ,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

2932, 2860, 1730

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.87 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.94 (3H, s), 1.00-1.49  
 (20H, m), 1.04 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.47  
 (3H, s), 1.52-2.38 (8H, m), 3.16-3.28 (1H, m),

3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.36-3.48 (1H, m), 3.68  
 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.82-3.94 (1H, m), 4.07 (1H,  
 s), 4.49 (1H, ddd,  $J=11\text{Hz}, 11\text{Hz}, 4\text{Hz}$ ), 5.52  
 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.82 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ ), 7.18  
 - 7.37 (10H, m)

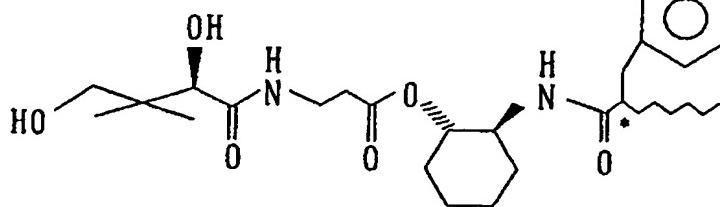
実施例139

化合物名: (1S, 2S)-2-(2-ベンジルカプリロイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 4-ジヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート

構造式:

(123)

245

分子式: C<sub>30</sub>H<sub>48</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 532.72

質量分析 計算値: 532.3512

実測値: 532.3524

融点(℃): カラメル

旋光度 [α]  $^{29}\text{D}$ ; +28.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

2936, 2864, 1728

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.86 (3H, t, J=7Hz), 0.94 (3H, s), 1.02 (3H, s),  
 1.06-1.50 (12H, m), 1.52-2.35 (9H, m), 2.64  
 (1H, dd, J=14Hz, 6Hz), 2.89 (1H, dd, J=14Hz, 8H)

\* z),

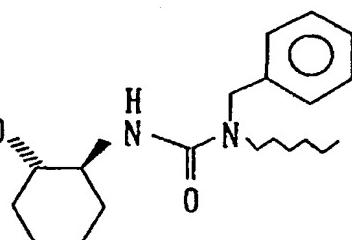
3.22-3.48 (2H, m), 3.48 (1H, d, J=11Hz), 3.51

10 (1H, d, J=11Hz), 3.72-3.87 (1H, m), 4.03 (1H, s), 4.54 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.88 (1H, br-s), 7.12-7.29 (6H, m)

実施例140

化合物名: (1S, 2S)-2-(N-ベンジル-N-ヘキシリカルバモイル)アミノシクロヘキサン-1-イル3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>32</sub>H<sub>51</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 573.78

質量分析 計算値: 573.3777

実測値: 573.3752

融点(℃): oil

旋光度 [α]  $^{28}\text{D}$ ; +33.2° (C=0.8, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3384, 2936, 2864, 1732

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 0.97-2.18 (16H, m), 1.03 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 2.32-2.53 (2H, m), 3.18 (2H, t, J=7Hz)

※ 3.26-3.39 (1H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.43

- 3.56 (1H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.72-

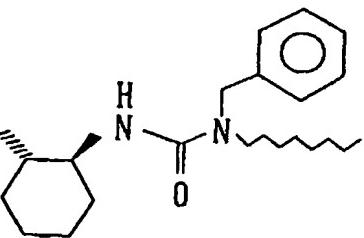
3.85 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.36 (1H, d, J=17Hz),

30 4.46 (1H, d, J=17Hz), 4.50 (1H, d, J=6Hz), 4.62 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 6.88 (1H, t, J=5Hz), 7.19-7.37 (5H, m)

実施例141

化合物名: (1S, 2S)-2-(N-ベンジル-N-オクチルカルバモイル)アミノシクロヘキサン-1-イル3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>34</sub>H<sub>55</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 601.83

質量分析 計算値: 601.4090

実測値: 601.4113

融点(℃): oil

旋光度 [α]  $^{28}\text{D}$ ; +29.7° (C=0.5, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

3368, 2932, 2864, 1732

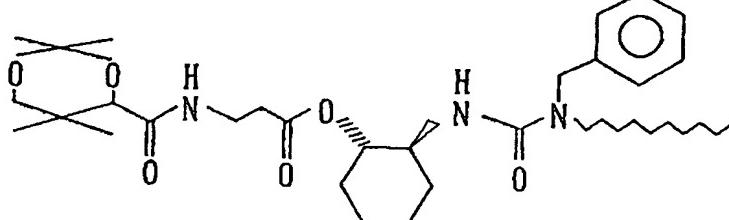
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

50 0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 0.97-2.18

(124)

247

(20H, m), 1.03 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.46  
 (3H, s), 2.33-2.53 (2H, m), 3.18 (2H, t, J=7Hz),  
 3.26-3.39 (1H, m), 3.28 (1H, m), 3.43-3.56  
 (1H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.72-3.85 (1H,  
 m), 4.07 (1H, s), 4.37 (1H, d, J=17Hz), 4.48  
 (1H, d, J=17Hz), 4.49 (1H, d, J=6Hz), 4.62 (1H,  
 ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 6.88 (1H, t, J=5Hz),

分子式: C<sub>36</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 629.88

質量分析 計算値: 629.4403

実測値: 629.4388

融点 (℃) : oil

旋光度 [α] <sub>27D</sub>; +26.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν, cm<sup>-1</sup>):

3384, 2932, 2860, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 0.79-2.19  
 (24H, m), 1.03 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.46  
 (3H, s), 2.32-2.53 (2H, m), 2.18 (2H, t, J=7Hz),

(124)

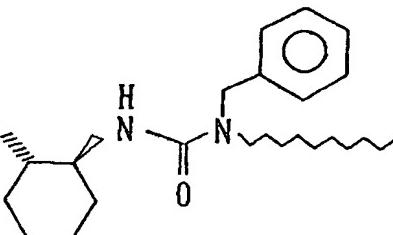
248

\* 7.19-7.36 (5H, m)

## 実施例142

化合物名: (1S, 2S)-2-(N-ベンジル-N-デシルカルバモイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

\* 構造式:

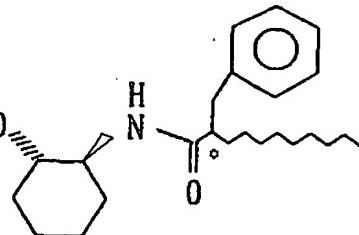


\* 3.23-3.38 (1H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.32  
 - 3.55 (1H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.70-  
 3.85 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.36 (1H, d, J=17Hz),  
 4.47 (1H, d, J=17Hz), 4.48 (1H, d, J=6Hz),  
 4.61 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 6.89 (1H, t,  
 20 J=5Hz), 7.20-7.39 (5H, m)

## 実施例143

化合物名: (1S, 2S)-2-(2-ベンジルウンデカノイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 614.87

質量分析 計算値: 614.4294

実測値: 614.4295

融点 (℃) : wax

旋光度 [α] <sub>28D</sub>; -7.7° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2860, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.62-1.49 (18H, m), 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.95  
 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.46  
 (3H, s), 1.51-1.95 (6H, m), 2.08-2.19 (1H, m),

2.37-2.56 (2H, m), 2.68 (2H, dd, J=14Hz, 6Hz),  
 2.83 (1H, dd, J=14Hz, 9Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz),  
 3.44-3.52 (2H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 3.70-  
 3.82 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.51 (1H, ddd,  
 J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.42 (1H, d, J=8Hz), 6.88  
 (1H, t, J=5Hz), 7.11-7.30 (5H, m)

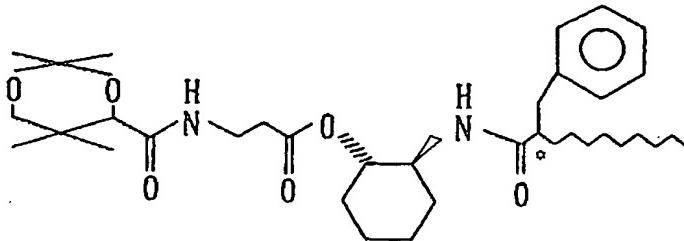
\* 実施例144

化合物名: (1S, 2S)-2-(2-ベンジルウンデカノイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

構造式:

(125)

249

分子式: C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 614.87

質量分析 計算値: 614.4294

実測値: 614.4276

融点(℃): oil

旋光度 [α]  $^{27}\text{D}$ ; +27.4° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>):

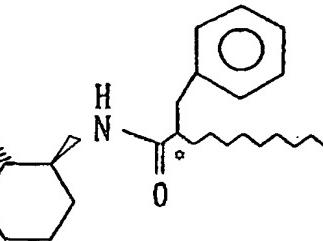
3304, 2932, 2860, 1734

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.95 (3H, s), 0.98-1.49  
(18H, m), 1.03 (3H, s), 1.43 (3H, s), 1.44  
(3H, s), 1.52-2.30 (9H, m), 2.61 (1H, dd,

(125)

250

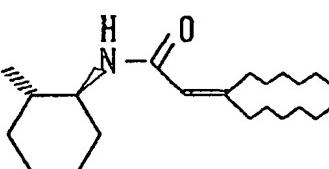


\* J = 14Hz, 6Hz), 2.94 (1H, dd, J=14Hz, 9Hz)  
3.22-3.29 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.69  
10 (1H, d, J=12Hz), 3.71-3.84 (1H, m), 4.07 (1H,  
s), 4.55 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),  
5.91 (1H, d, J=8Hz), 6.81 (1H, t, J=5Hz),  
7.12-7.28 (5H, m)

## 実施例145

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (3 - ヘキシリル - 2 - ノネノイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

分子式: C<sub>33</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 578.93

IR ( $\nu$  neat, cm<sup>-1</sup>): 1660, 1736NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

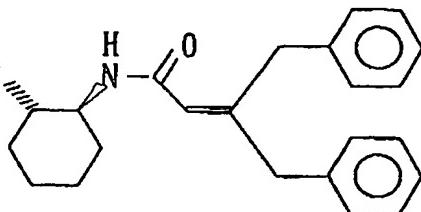
0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96  
(3H, s), 1.04 (3H, s), 1.10-1.50 (16H, m),  
1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.57-1.88 (6H, m),  
1.88-2.18 (4H, m), 2.43-2.64 (4H, m), 3.28  
(1H, d, J=12Hz), 3.49 (1H, td, J=6Hz), 3.69

\* (1H, d, J=12Hz), 3.84-4.02 (1H, m), 4.08 (1H,  
s), 4.64 (1H, td, J= Hz), 5.42 (1H, s),  
5.67 (1H, d, J= Hz), 6.92 (1H, m)

## 実施例146

30 化合物名: (1S, 2S) - 2 - (3 - フェニルメチル - 4 - フェニル - 2 - プテノイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

分子式: C<sub>35</sub>H<sub>46</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 590.83

融点(℃): wax

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.93 (3H, s), 1.00 (3H, s), 0.90-2.12 (8H, m),  
1.39 (3H, s), 1.45 (3H, s), 2.24-2.54 (2H, m),  
3.07 (1H, dd, J= Hz, 3Hz), 3.26 (1H, d, J=12Hz),  
3.20-3.64 (2H, m), 3.53 (2H, dd, J=15Hz, 5Hz),  
3.67 (1H, d, J=12Hz), 3.80-3.94 (1H, m), 4.04

(1H, s), 4.60 (1H, ddd, J= Hz, 10Hz, 4Hz),  
5.76 (1H, d, J=8Hz), 6.60 (1H, s), 6.84 (1H, t,  
J= Hz), 7.16-7.42 (10H, m)

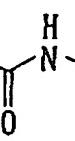
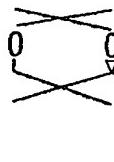
## 実施例147

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (3 - プロピル - 2 - ノネノイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

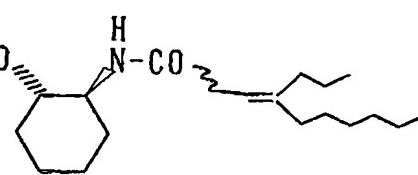
(126)

251



(126)

252

分子式: C<sub>30</sub>H<sub>52</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 536.84

融点(℃): wax

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

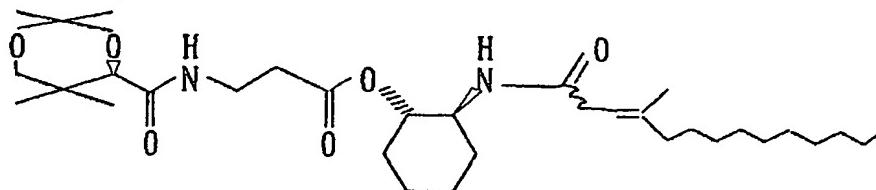
0.80-0.96 (6H, m), 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
1.06-2.21 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
2.40-2.67 (4H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz),  
3.49 (2H, td, J=6Hz, 6Hz), 3.69 (1H, d, J=12Hz),  
3.94 (1H, ddd, J=10Hz, 8Hz, 4Hz), 4.08 (1H, s),

\* 4.64 (1H, ddd, J=10Hz, 10Hz, 4Hz), 5.42+5.44  
(1H, s), 5.67+5.70 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H,  
t, J=6Hz)

10 実施例148

化合物名: (1S, 2S)-2-(3-メチル-2-トリデセノイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:



## (E, Z-Mixture)

分子式: C<sub>32</sub>H<sub>56</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 564.80

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

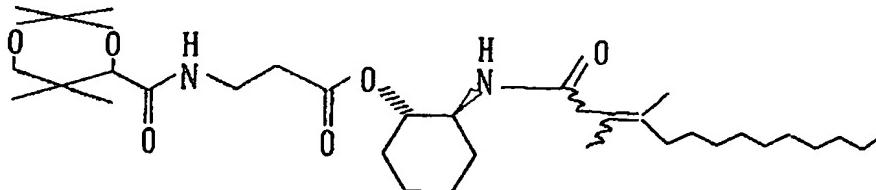
0.88 (3H, t, J=6Hz), 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
1.10-2.21 (26H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
2.12 (3H, s), 2.50 (2H, t, J=5Hz), 3.28 (1H, d,  
J=12Hz), 3.41-3.57 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=  
12Hz), 3.86-4.01 (1H, m), 4.09 (1H, s),

\* 4.65 (1H, ddd, J=10Hz, 10Hz, 4Hz), 5.48 (1H, d,  
J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=5Hz)

実施例149

化合物名: (1S, 2S)-2-(2,3-ジメチル-2-トリデセノイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

30 構造式:



## (E, Z-Mixture)

分子式: C<sub>33</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 578.93

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=6Hz), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
1.07-2.21 (26H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
1.63 (3H, s), 1.75 (3H, s), 2.53 (2H, t, J=6Hz),  
3.28 (1H, d, J=12Hz), 3. -3.64 (2H, m), 3.69  
(1H, d, J=12Hz), 3.88-4.04 (1H, m), 4.08 (1H,

40 ) , 4.68 (1H, ddd, J=10Hz, 10Hz, 4Hz), 5.23+  
5.58 (1H, d, J=9Hz), 6.92 (1H, t, J=5Hz)

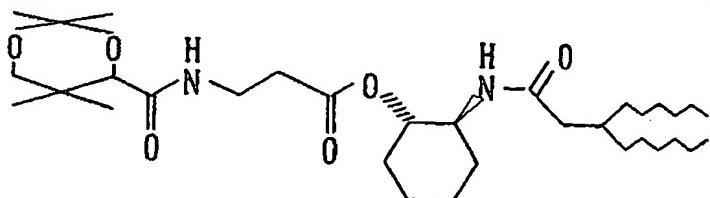
実施例150

化合物名: (1S, 2S)-2-(3-ヘキシリノナノイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

(127)

253

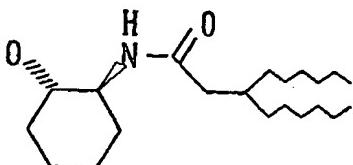
分子式: C<sub>33</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 580.95

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.87 (6H, t, J=6Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.10-2.20 (31H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 2.50 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz),  
 3.36-3.60 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.88  
 (1H, m), 4.09 (1H, s), 4.64 (1H, ddd, J=10Hz),

254

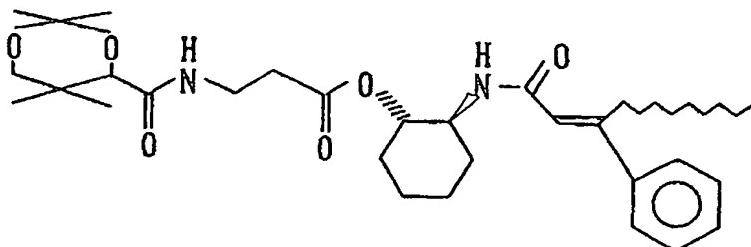


\* 10Hz, 4Hz), 5.88 (1H, d, J=8Hz), 6.91 (1H, t, J=6Hz)  
 z)

実施例151

<sup>10</sup> 化合物名: (1S, 2S) - 2 - [(E) - 3 - フェニル - 2 - ドセノイル] アミノシクロヘキサン - 1 - イル  
 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

分子式: C<sub>36</sub>H<sub>56</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 612.94

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

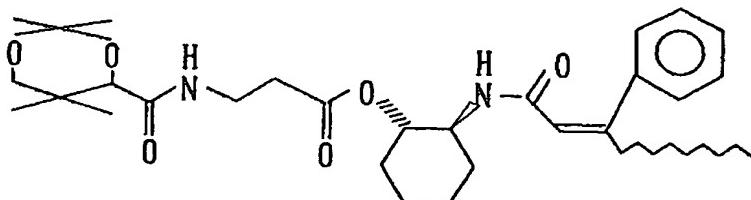
0.55-0.73 (1H, m), 0.97 (3H, t, J=6Hz), 0.96  
 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.08-2.84 (21H, m),  
 1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.30-2.43 (2H, m),  
 2.48 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz),  
 3.33-3.62 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz),  
 3.70-3.86 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.28 (1H,

\* ddd, J=10Hz, 10Hz, 4Hz), 5.06 (1H, d, J=9Hz),  
 5.85 (1H, s), 6.92 (1H, t, J=6Hz), 7.12-7.43  
 (5H, m)

実施例152

化合物名: (1S, 2S) - 2 - [(Z) - 3 - フェニル - 2 - ドセノイル] アミノシクロヘキサン - 1 - イル  
 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

分子式: C<sub>36</sub>H<sub>56</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 612.94

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.86 (3H, t, J=7Hz), 0.90 (3H, s), 0.99 (3H, s),  
 1.03-2.28 (22H, m), 1.39 (3H, s), 1.44 (3H, s),  
 2.40-2.6 (2H, m), 2.90-3.20 (2H, m), 3.25  
 (1H, d, J=12Hz), 3.36-3.63 (2H, m), 3.66 (1H,  
 d, J=12Hz), 3.91-4.02 (1H, m), 4.06 (1H, s),  
 4.65 (1H, ddd, J=10Hz, 10Hz, 4Hz), 5.82 (1H, s),

6.04 (1H, d, J=8Hz), 6.91 (1H, t, J=6Hz),  
 7.29-7.44 (5H, m)

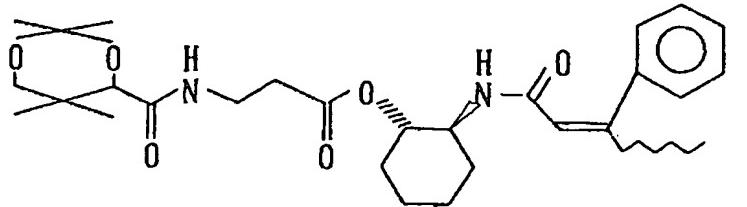
実施例153

化合物名: (1S, 2S) - 2 - [(Z) - 3 - フェニル - 2 - ノネノイル] アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

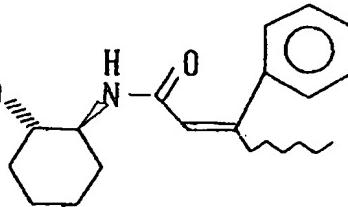
構造式:

(128)

255



256

分子式: C<sub>33</sub>H<sub>50</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 570.85

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

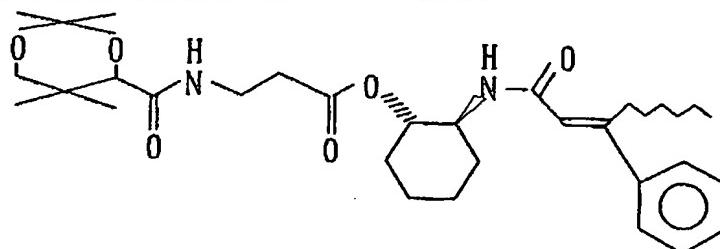
0.83 (3H, t, J=7Hz), 0.90 (3H, s), 0.99 (3H, s),  
1.08-2.60 (18H, m), 1.39 (3H, s), 1.44 (3H, s),  
2.94-3.20 (2H, m), 3.25 (1H, d, J=12Hz), 3.38  
- 3.61 (2H, m), 3.66 (1H, d, J=12Hz), 3.90-  
4.04 (1H, m), 4.06 (1H, s), 4.65 (1H, ddd, J=11

\* Hz, 11Hz, 4Hz), 5.82 (1H, s), 6.01 (1H, d, J=6Hz),  
6.91 (1H, t, J=6Hz), 7.29-7.44 (5H, m)

10 実施例154

化合物名: (1S, 2S) - 2 - [(E) - 3 - フェニル-  
2 - ノネノイル] アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3  
- [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン -  
4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

分子式: C<sub>33</sub>H<sub>50</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 570.85

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

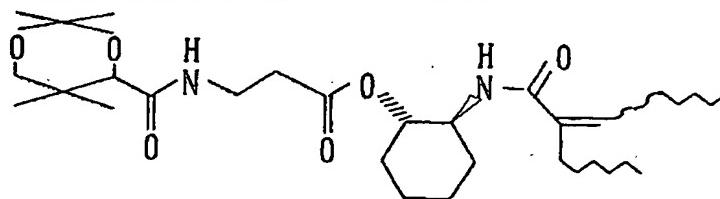
0.55-0.72 (1H, m), 0.85 (3H, t, J=7Hz), 0.96  
(3H, s), 1.04 (3H, s), 0.88-1.99 (15H, m),  
1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.29-2.34 (2H, m),  
2.48 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz),  
3.32-3.61 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz),  
3.71-3.84 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.28 (1H, ddd,

\* J = 10Hz, 10Hz, 4Hz), 5.07 (1H, d, J=9Hz),  
5.85 (1H, s), 6.92 (1H, t, J=6Hz), 7.13-7.45  
(5H, m)

実施例155

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2 - ヘキシリデンオクタ  
ノイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N -  
30 (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カル  
ボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

分子式: C<sub>32</sub>H<sub>56</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 564.90

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.87 (3H, t, J=8Hz), 0.88 (3H, t, J=8Hz), 0.96  
(3H, s), 1.03 (3H, s), 1.07-2.26 (26H, m),  
1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 2.40-2.66 (2H, m),  
3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.37-3.64 (2H, m), 3.69  
(1H, d, J=12Hz), 3.90-4.06 (1H, m), 4.07 (1H,  
s), 4.70 (1H, ddd, J=10Hz, 10Hz, 4Hz), 5.38

40 (1H, t, J=7Hz), 5.61 (1H, d, J=8Hz), 6.91 (1H,

t, J=6Hz)

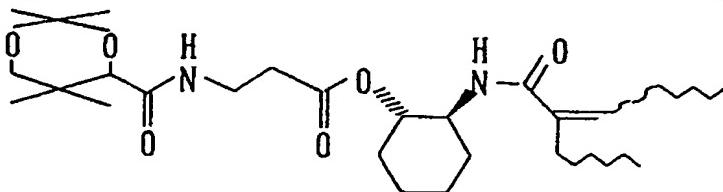
実施例156

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2 - ヘキシリデンオクタ  
ノイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N -  
(2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カル  
ボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

(129)

257

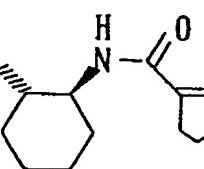
分子式: C<sub>32</sub>H<sub>56</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 564.90

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.89 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.06-2.33 (26H, m), 1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.40-2.60 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.32-3.62 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.86-4.02 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.74 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.82

258



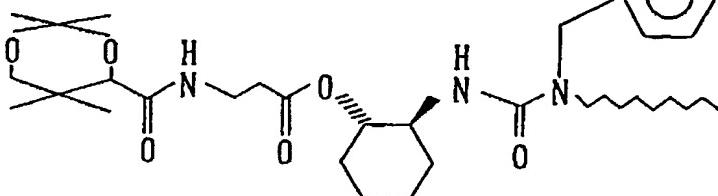
\* (1H, d, J=8Hz), 6.01 (1H, t, J=7Hz), 6.90 (1H, t, J=6Hz)

実施例157

10 化合物名: (1S, 2S) - 2 - (N - ベンジル - N - ノニルカルバモイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

\*

分子式: C<sub>35</sub>H<sub>57</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 615.86

融点(℃): oil

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.05-2.23 (22H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 2.32-2.53 (2H, m), 3.17 (2H, t, J=7Hz), 3.25-3.39 (1H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.42-3.55 (1H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 3.71-3.83 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.36 (1H, d, J=16Hz), 4.46

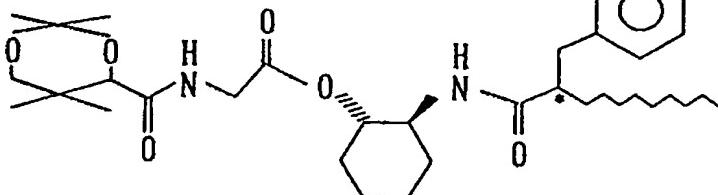
\* (1H, d, J=16Hz), 4.47 (1H, d, J=8Hz), 4.62 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 4.87 (1H, t, J=6Hz), 7.20-7.37 (5H, m)

実施例158

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2 - ベンジルウンデカノイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノアセテート

構造式:

\*

分子式: C<sub>35</sub>H<sub>56</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 600.84

融点(℃): oil

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.02 (3H, s), 1.08 (3H, s), 1.12-2.24 (25H, m), 1.46 (3H, s), 1.54 (3H, s), 2.61 (1H, dd, J=13Hz, 5Hz), 2.92 (1H, dd, J=13Hz, 9Hz), 3.22 (1H, dd, J=18Hz, 5Hz), 3.31 (1H, d, J=12Hz), 3.70-3.84 (1H, m), 3.71 (1H, d, J=12Hz), 3.94 (1H, dd, J=18Hz, 7Hz), 4.13

(1H, s), 4.62 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.51 (1H, d, J=8Hz), 6.64-6.72 (1H, m), 7.14-7.21 (3H, m), 7.23-7.32 (2H, m)

実施例159

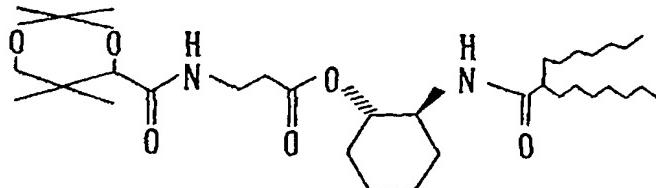
化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2 - ヘプチルノナノイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

50

(130)

259



260

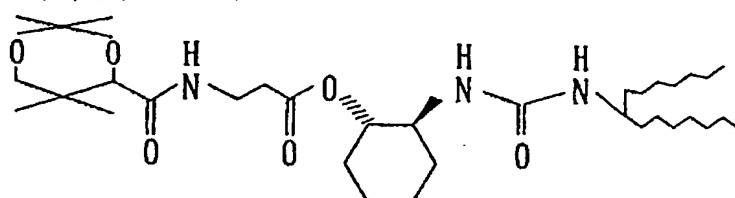
\*  $J = 11\text{Hz}, 11\text{Hz}, 4\text{Hz}$  , 5.80 (1H, d,  $J = 8\text{Hz}$ ) , 6.91 (1H, t,  $J = 6\text{Hz}$ )

## 実施例160

10 化合物名：(1S,2S) - 2 - [(1-ヘプチルオクチル)カルバモイル]アミノシクロヘキサン-1-イル3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式：

\*

分子式 : C<sub>34</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 594.88

融点 (℃) : wax

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) :

0.87 (6H, t,  $J = 7\text{Hz}$ ) , 0.96 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.08-2.21 (33H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) , 2.41-2.58 (2H, m) , 3.28 (1H, d,  $J = 12\text{Hz}$ ) , 3.51 (2H, dt,  $J = 6\text{Hz}, 6\text{Hz}$ ) , 3.69 (1H, d,  $J = 12\text{Hz}$ ) , 3.82-3.95 (1H, m) , 4.08 (1H, s) , 4.68 (1H, ddd,

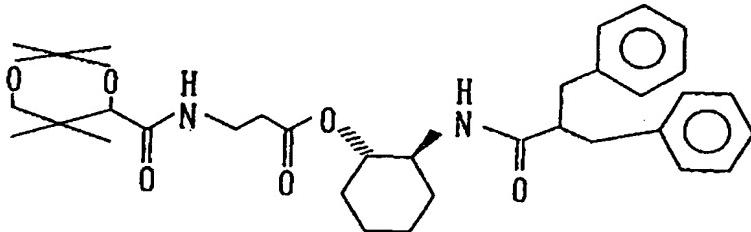
\* 4.55 (1H, ddd,  $J = 11\text{Hz}, 11\text{Hz}, 4\text{Hz}$ ) , 4.83 (1H, br-s) , 6.90 (1H, t,  $J = 6\text{Hz}$ )

## 実施例161

化合物名：(1S,2S) - 2 - (2-ベンジル-3-フェニルプロパノイル)アミノシクロヘキサン-1-イル3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式：

※30

分子式 : C<sub>34</sub>H<sub>46</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 578.75

融点 (℃) : カラメル

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) :

0.94 (3H, s) , 0.95-2.23 (10H, m) , 1.03 (3H, s) , 1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 2.43-2.56 (1H, m) , 2.68-3.09 (4H, m) , 3.15-3.32 (2H, m) , 3.27 (2H, d,  $J = 12\text{Hz}$ ) , 3.59-3.69 (1H, m) , 3.68 (1H, d,  $J = 12\text{Hz}$ ) , 4.06 (1H, s) , 4.35 (1H, ddd,

$J = 11\text{Hz}, 11\text{Hz}, 4\text{Hz}$  , 5.38 (1H, d,  $J = 8\text{Hz}$ ) , 6.77 (1H, t,  $J = 6\text{Hz}$ ) , 7.12-7.28 (10H, m)

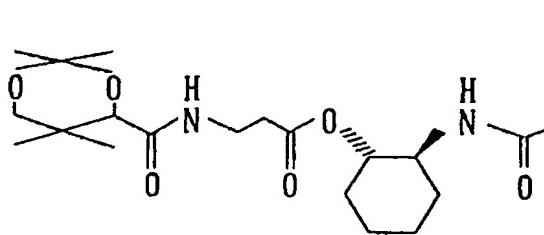
## 40 実施例162

化合物名：(1S,2S) - 2 - [5-フェニル-2 - (3-フェニルプロピル)ペンタノイル]アミノシクロヘキサン-1-イル3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式：

(131)

261

分子式: C<sub>38</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 634.86

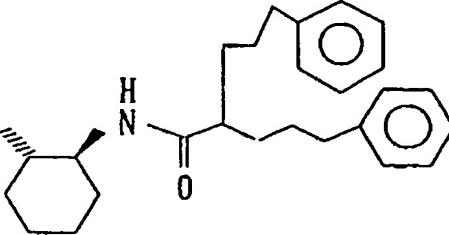
融点(℃) : カラメル

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.93 (3H, s), 0.98-2.27 (19H, m), 1.02 (3H, s),  
 1.41 (3H, s), 1.46 (3H, s), 2.48-2.64 (4H, m),  
 3.12-3.28 (2H, m), 3.27 (1H, d, J=12Hz), 3.67  
 (1H, d, J=12Hz), 3.78-3.91 (1H, m), 4.05 (1H,  
 s), 4.59 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.87

(131)

262

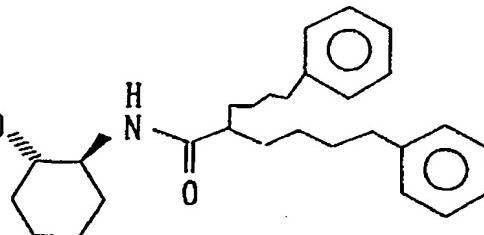


\* (1H, d, J=8Hz), 6.75 (1H, t, J=6Hz), 7.11-  
 7.30 (10H, m)

10 実施例163

化合物名: (1S, 2S)-2-[6-フェニル-2-(4-フェニルブチル)ヘキサノイル]アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

\* 構造式:

分子式: C<sub>40</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 662.91

融点(℃) : oil

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

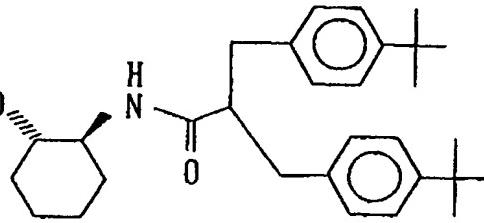
0.84-2.14 (21H, m), 0.94 (3H, s), 1.01 (3H, s),  
 1.41 (3H, s), 1.45 (3H, s), 2.32-2.61 (6H, m),  
 3.27 (1H, d, J=8Hz), 3.37-3.53 (2H, m), 3.67  
 (1H, d, J=8Hz), 3.78-3.92 (1H, m), 4.06 (1H,  
 s), 4.62 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.82

※ (1H, d, J=8Hz), 6.86 (1H, t, J=6Hz), 7.11-  
 7.29 (10H, m)

実施例164

化合物名: (1S, 2S)-2-[2-(4-tert-ブチルベンジル)-3-(4-tert-ブチルフェニル)プロパノイル]アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

※ 構造式:

分子式: C<sub>42</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 690.97

融点(℃) : カラメル

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>):

0.94 (3H, s), 1.02 (3H, s), 1.05-1.84 (8H, m),  
 1.28 (9H, s), 1.29 (9H, s), 1.41 (3H, s),  
 1.46 (3H, s), 2.12-2.34 (2H, m), 2.48-2.58

40 (1H, m), 2.66-3.04 (4H, m), 3.27 (1H, d, J=12Hz), 3.33 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.61-3.73  
 (1H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.06 (1H, s),  
 4.38 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.32 (1H, t,  
 J=8Hz), 6.83 (1H, t, J=6Hz), 7.06 (2H, d, J=8Hz),  
 7.11 (2H, d, J=8Hz), 7.26 (2H, d, J=8Hz),  
 7.28 (2H, d, J=8Hz)

(132)

## フロントページの続き

(51) Int. Cl. 6	識別記号	府内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 C 237/22			C 0 7 C 237/22	
327/20			327/20	
C 0 7 D 319/06			C 0 7 D 319/06	